

(12) NACH DEM VERTRAG FÜR DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

24 JAN 2005

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
29. Januar 2004 (29.01.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/009561 A1(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07D 239/54**,
401/12, 403/12, A01N 43/54, 43/84Höhenweg 12b, 67098 Bad Dürkheim (DE). LANDES,
Andreas [DE/DE]; Grünwaldstrasse 15, 67354 Römer-
berg-Heiligenstein (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/008013

(74) Anwälte: KINZEBACH, Werner usw.; Ludwigsplatz 4,
67059 Ludwigshafen (DE).(22) Internationales Anmeldedatum:
22. Juli 2003 (22.07.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 33 402.1 23. Juli 2002 (23.07.2002) DE(81) Bestimmungsstaaten (*national*): AE, AG, AL, AM, AT,
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,
CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE,
GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR,
KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,
MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO,
RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ,
UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): BASF AKTIENGESellschaft [DE/DE];
67056 Ludwigshafen (DE).(84) Bestimmungsstaaten (*regional*): ARIPO-Patent (GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,
TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE,
DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL,
PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): PUHL, Michael
[DE/DE]; Bübstädter Strasse 95, 68623 Lampertheim (DE).
HAMPRECHT, Gerhard [DE/DE]; Rote-Turm-Strasse
26, 69469 Weinheim (DE). REINHARD, Robert
[DE/DE]; Wielandstr. 30, 67065 Ludwigshafen (DE).
SAGASSER, Ingo [DE/DE]; Schlesienstrasse 13,
67125 Dannstadt-Schauernheim (DE). SEITZ, Werner
[DE/DE]; Bismarckstrasse 22a, 68167 Plankstadt (DE).
ZAGAR, Cyrill [DE/DE]; Untere Clignetstrasse 8, 68167
Mannheim (DE). WITSCHER, Matthias [DE/DE];

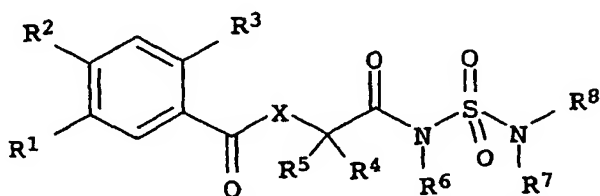
Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der
PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: 3-HETEROCYCLYL SUBSTITUTED BENZOIC ACID DERIVATIVES

(54) Bezeichnung: 3-HETEROCYCLYL SUBSTITUIERTE BENZOESÄURE-DERIVATE



(I)

(57) Abstract: Disclosed are 3-heterocy-
cyl substituted benzoic acid derivatives
of general formula (I), in which the vari-
ables R¹ to R⁸ and X have the meanings
indicated in claim 1, and the use thereof
as herbicides or for desiccating/defoliat-
ing plants.(57) Zusammenfassung: Beschrieben werden 3-Heterocyclyl substituierte Benzoessäure-Derivate der allgemeinen Formel (I), worin die Variablen R¹ bis R⁸ und X die in Anspruch 1 genannten Bedeutungen aufweisen und deren Salze sowie ihre Verwendung als Herbizide oder zur Desikkation/Defoliation von Pflanzen.

3-Heterocyclyl substituierte Benzoessäure-Derivate

Beschreibung

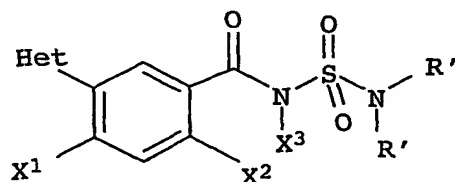
5

Die vorliegende Erfindung betrifft 3-Heterocyclyl substituierte Benzoessäure-Derivate und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze, Mittel die derartige Verbindungen enthalten sowie die Verwendung der 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate, ihrer Salze oder Mittel, die diese enthalten, als Herbizide, Desikkantien oder Defoliantien.

Verschiedentlich wurden Uracil substituierte Benzoessäure-Derivate als herbizid wirksame Verbindungen beschrieben. So beschreiben z. B. die WO 88/10254, WO 89/03825 und die WO 91/00278 die Ester von 2-Halogen-5-(substituiertes Uracil)-benzoessäuren und die Ester von 2-Cyano-5-(substituiertes Uracil)-benzoessäuren, die gegebenenfalls in 4-Stellung mit Halogen substituiert sein können. Die WO 89/02891 und die WO 93/06090 beschreiben die Amide von 2-Halogen-5-(substituiertes Uracil)-benzoessäuren und die Amide von 2-Cyano-5-(substituiertes Uracil)-benzoessäuren, die gegebenenfalls in 4-Stellung mit Halogen substituiert sein können, als herbizid wirksame Substanzen.

Weiterhin sind aus der WO 01/83459 herbizid wirksame 3-Heterocyclyl substituierte Phenylsulfamoylcarboxamide der Formel A bekannt,

30



A

35

40

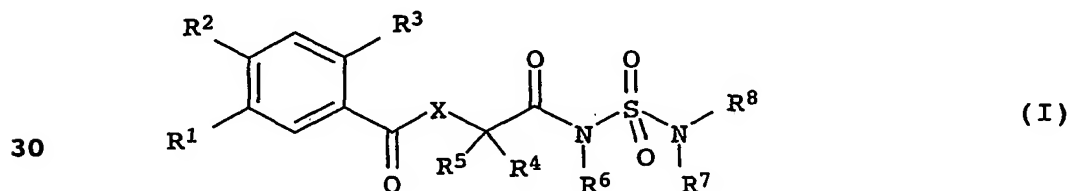
45

worin Het u.a. für einen ungesättigten, fünf- oder sechsgliedrigen, heterocyclischen Rest, der über ein Stickstoffatom an den Phenylring gebunden ist, steht, X^1 für Wasserstoff, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl steht, X^2 für Wasserstoff, Cyano, Thiocarbamoyl, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl steht, X^3 u. a. für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxyalkyl steht, R' jeweils unabhängig voneinander u. a. für Wasserstoff, Alkoxy, C_1 - C_{10} -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl, C_3 - C_{10} -Alkinyl, C_3 - C_7 -Cycloalkyl stehen oder die beiden Reste R' bilden gemeinsam mit dem Stickstoff-Atom, an das sie gebunden sind, einen 3- bis 7-gliedrigen heterocyclischen Ring.

Der vorliegenden Erfindung liegt die Aufgabe zugrunde, neue herbizid wirksame Verbindungen bereitzustellen, mit denen sich unerwünschte Pflanzen besser als mit den bekannten Herbiziden gezielt bekämpfen lassen. Die neuen Herbizide sollen vorteilhafterweise eine hohe Aktivität gegenüber Schadpflanzen aufweisen. Außerdem ist eine hohe Kulturpflanzenverträglichkeit erwünscht. Die Aufgabe erstreckte sich auch auf die Bereitstellung neuer desikant/defoliant wirksamer Verbindungen.

Es wurde nun überraschenderweise gefunden, dass diese Aufgabe durch 3-Heterocyclyl substituierte Benzoesäure-Derivate der nachstehend definierten allgemeinen Formel I gelöst wird:

25



35

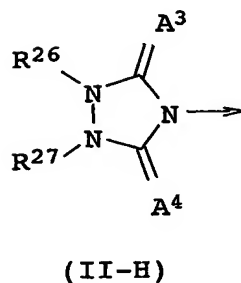
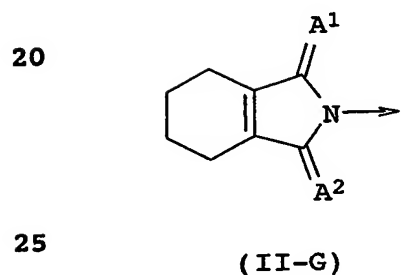
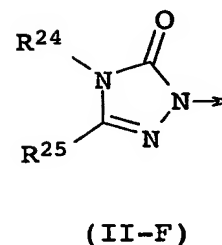
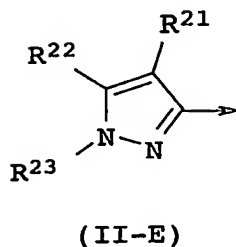
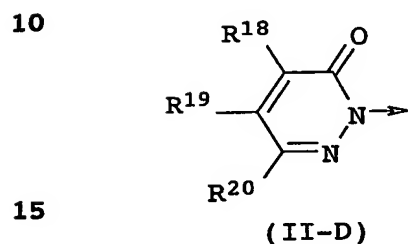
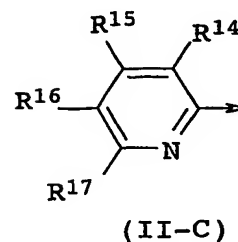
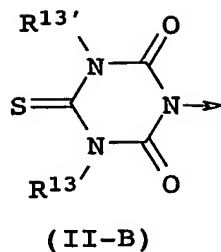
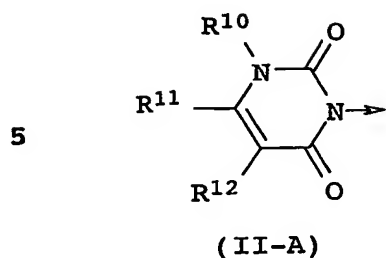
worin die Variablen die folgenden Bedeutungen haben:

X Sauerstoff oder NR^9 ,

40 R^1 heterocyclischer Rest der allgemeinen Formeln II-A bis II-H,

45

3



R² Wasserstoff oder Halogen,

30 R³ Halogen oder Cyano,

R⁴, R⁵ unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy, oder R⁴ und R⁵ stehen gemeinsam für eine Gruppe =CH₂,

35

R⁶ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy,

40

R⁷, R⁸ unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl, Cyano-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Amino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylamino-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₄-alkyl)amino-C₁-C₄-alkyl, Aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₄-Alkylamino)carbonyl-C₁-C₄-alkyl,

45

Di(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl,
Phenyl oder C₁-C₄-Alkylphenyl oder

- 5 R⁷ und R⁸ bilden gemeinsam mit dem Stickstoff-Atom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten 3-, 4-, 5-, 6- oder 7-gliedrigen Stickstoffheterocyclus, der gegebenenfalls ein oder zwei weitere Heteroatome, ausgewählt unter Stickstoff, Schwefel und Sauerstoff, als Ringglieder enthalten kann, der 1 oder 2 Carbonyl- und/oder Thiocarbonylgruppen als Ringglied enthalten kann, und/oder durch ein, zwei oder drei Substituenten, ausgewählt unter C₁-C₄-Alkyl und Halogen, substituiert sein kann,
- 10 R⁹ Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-Alkenyl oder C₃-C₆-Alkynyl,
- 15 R¹⁰ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder Amino,
R¹¹ C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl,
R¹² Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl,
- 20 R¹³, R^{13'} unabhängig voneinander Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl,
- R¹⁴ Halogen,
R¹⁵ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl,
- 25 R¹⁶ C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyloxy,
R¹⁷ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl,
- R¹⁸ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder Amino,
- 30 R¹⁹ C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkylthio oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl,
R²⁰ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl,
- R²¹ Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl,
R²² C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy,
- 35 C₁-C₄-Alkylthio oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl,
R²³ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl,
oder
R²² und R²³ bilden gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden sind, einen 5-, 6- oder 7-gliedrigen, gesättigten oder ungesättigten Ring, der ein Heteroatom, das ausgewählt ist unter Sauerstoff und Stickstoff, als ringbildendes Atom enthalten kann, und/oder der durch ein, zwei oder drei Reste, ausgewählt unter C₁-C₄-Alkyl und Halogen, substituiert sein kann,
- 40 R²⁴ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl,
R²⁵ C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl,
oder
- 45

5

R²⁴ und R²⁵ bilden gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden sind, einen 5-, 6- oder 7-gliedrigen, gesättigten oder ungesättigten Ring, der gegebenenfalls ein Sauerstoffatom als ringbildendes Atom enthält, und/oder der durch ein, zwei oder drei Reste, ausgewählt unter C₁-C₄-Alkyl und Halogen, substituiert sein kann,

R²⁶ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl,

R²⁷ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl,

10 oder

R²⁶ und R²⁷ bilden gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden sind, einen 5-, 6- oder 7-gliedrigen, gesättigten oder ungesättigten Ring, der gegebenenfalls ein Sauerstoffatom als ringbildendes Atom enthält, und/oder der durch ein, zwei oder drei Reste, ausgewählt unter C₁-C₄-Alkyl und Halogen, substituiert sein kann,

A¹, A², A³, A⁴ jeweils unabhängig voneinander Sauerstoff oder Schwefel.

20

Die vorliegende Erfindung betrifft demnach 3-Heterocyclyl substituierte Benzoessäure-Derivate der allgemeinen Formel I sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

25 Die Erfindung betrifft auch die Tautomere der Verbindungen I, z. B. solche Verbindungen I, in denen R¹ für einen heterocyclischen Rest der Formel II-A, II-B, II-F oder II-H steht.

Außerdem betrifft die Erfindung

- 30 - die Verwendung von Verbindungen I und/oder ihre Salze als Herbizide oder zur Desikkation/Defoliation von Pflanzen
- herbizide Mittel, welche die Verbindungen I und/oder ihre Salze als wirksame Substanzen enthalten,
- Mittel zur Desikkation/Defoliation von Pflanzen, welche die Verbindungen I und/oder ihre Salze als wirksame Substanzen
- 35 enthalten, sowie
- Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs oder zur Desikkation/Defoliation von Pflanzen mit den Verbindungen I und/oder ihrer Salze.

40

Die Verbindungen der Formel I können je nach Substitutionsmuster ein oder mehrere Chiralitätszentren aufweisen und liegen dann als Enantiomeren- oder Diastereomeregemische vor. Gegenstand der Erfindung sind sowohl die reinen Enantiomere oder Diastereomere

45 als auch deren Gemische.

Unter landwirtschaftlich brauchbaren Salzen kommen vor allem die Salze derjenigen Kationen oder die Säureadditionssalze derjenigen Säuren in Betracht, deren Kationen beziehungsweise Anionen die herbizide Wirkung und/oder desikkante/defoliantische Wirkung der Verbindungen I nicht negativ beeinträchtigen. So kommen als Kationen insbesondere die Ionen der Alkalimetalle, vorzugsweise Natrium und Kalium, der Erdalkalimetalle, vorzugsweise Calcium, Magnesium und Barium, und der Übergangsmetalle, vorzugsweise Mangan, Kupfer, Zink und Eisen, sowie das Ammoniumion, das gewünschtenfalls ein bis vier C₁-C₄-Alkylsubstituenten und/oder einen Phenyl- oder Benzylsubstituenten tragen kann, vorzugsweise Diisopropylammonium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, Trimethylbenzylammonium, des weiteren Phosphoniumionen, Sulfoniumionen, vorzugsweise Tri(C₁-C₄-alkyl)sulfonium und Sulfoxoniumionen, vorzugsweise Tri(C₁-C₄-alkyl)sulfoxonium, in Betracht.

Anionen von brauchbaren Säureadditionssalzen sind in erster Linie Chlorid, Bromid, Fluorid, Hydrogensulfat, Sulfat, Dihydrogenphosphat, Hydrogenphosphat, Phosphat, Nitrat, Hydrogencarbonat, Carbonat, Hexafluorosilikat, Hexafluorophosphat, Benzoat, sowie die Anionen von C₁-C₄-Alkansäuren, vorzugsweise Formiat, Acetat, Propionat und Butyrat. Sie können durch Reaktion von I mit einer Säure des entsprechenden Anions, vorzugsweise der Chlorwasserstoffsäure, Bromwasserstoffsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure oder Salpetersäure, gebildet werden.

Die bei der Definition der Substituenten R¹ bis R²⁷ oder als Reste an heterocyclischen Ringen genannten organischen Molekülteile stellen - wie die Bedeutung Halogen - Sammelbegriffe für individuelle Aufzählungen der einzelnen Gruppenmitglieder dar. Sämtliche Kohlenstoffketten, also alle Alkyl-, Halogenalkyl-, Cyanoalkyl-, Aminoalkyl-, Aminocarbonylalkyl-, Alkoxy-, Halogenalkoxy-, Alkylthio-, Halogenalkylthio-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Alkylsulfonyloxy-, Alkenyl-Teile können geradkettig oder verzweigt sein. Halogenierte Substituenten tragen vorzugsweise ein bis fünf gleiche oder verschiedene Halogenatome. Die Bedeutung Halogen steht jeweils für Fluor, Chlor, Brom oder Iod.

Ferner stehen beispielsweise:

40

- C₁-C₄-Alkyl für: z. B. Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl oder 1,1-Dimethylethyl;

45

- C₁-C₆-Alkyl für: C₁-C₄-Alkyl, wie voranstehend genannt, sowie z. B. n-Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl,

- 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl,
1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl,
2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl,
2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl
5 oder 1-Ethyl-3-methylpropyl;
- C₁-C₄-Halogenalkyl für: einen C₁-C₄-Alkylrest, wie vorstehend
genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor,
Brom und/oder Iod substituiert ist, also z. B. Chlormethyl,
10 Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl,
Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl,
Chlordifluormethyl, 2-Fluorethyl, 2-Chlorethyl, 2-Bromethyl,
2-Iodethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl,
2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl,
15 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl,
Pentafluorethyl, 2-Fluorpropyl, 3-Fluorpropyl,
2,2-Difluorpropyl, 2,3-Difluorpropyl, 2-Chlorpropyl,
3-Chlorpropyl, 2,3-Dichlorpropyl, 2-Brompropyl, 3-Brompropyl,
3,3,3-Trifluorpropyl, 3,3,3-Trichlorpropyl,
20 2,2,3,3,3-Pentafluorpropyl, Heptafluorpropyl,
1-(Fluormethyl)-2-fluorethyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethyl,
1-(Brommethyl)-2-bromethyl, 4-Fluorbutyl, 4-Chlorbutyl,
4-Brombutyl oder Nonafluorbutyl; insbesondere für
Difluormethyl, Trifluormethyl;
- 25 — C₁-C₄-Alkoxy für: z. B. Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy,
1-Methylethoxy, Butoxy, 1-Methylpropoxy, 2-Methylpropoxy oder
1,1-Dimethylethoxy;
- 30 — C₁-C₄-Halogenalkoxy für: einen C₁-C₄-Alkoxyrest wie vorstehend
genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor,
Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. OCH₂F, OCHF₂,
OCF₃, OCH₂Cl, OCH(Cl)₂, OC(Cl)₃, Chlorfluormethoxy,
Dichlorfluormethoxy, Chlordifluormethoxy, 2-Fluorethoxy,
35 2-Chlorethoxy, 2-Bromethoxy, 2-Iodethoxy, 2,2-Difluorethoxy,
2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2-fluorethoxy,
2-Chlor-2,2-difluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy,
2,2,2-Trichlorethoxy, OC₂F₅, 2-Fluorpropoxy, 3-Fluorpropoxy,
2,2-Difluorpropoxy, 2,3-Difluorpropoxy, 2-Chlorpropoxy,
40 3-Chlorpropoxy, 2,3-Dichlorpropoxy, 2-Brompropoxy,
3-Brompropoxy, 3,3,3-Trifluorpropoxy, 3,3,3-Trichlorpropoxy,
OCH₂-C₂F₅, OCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluorethoxy,
1-(CH₂Cl)-2-chlorethoxy, 1-(CH₂Br)-2-bromethoxy,
4-Fluorbutoxy, 4-Chlorbutoxy, 4-Brombutoxy oder
45 Nonafluorbutoxy, vorzugsweise für OCHF₂;

- C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl für: durch C₁-C₄-Alkoxy - wie vorstehend genannt - substituiertes C₁-C₄-Alkyl, also z.B. für CH₂-OCH₃, CH₂-OC₂H₅, n-Propoxymethyl, CH₂-OCH(CH₃)₂, n-Butoxymethyl, (1-Methylpropoxy)methyl, (2-Methylpropoxy)methyl, CH₂-OC(CH₃)₃, 2-(Methoxy)ethyl, 2-(Ethoxy)ethyl, 2-(n-Propoxy)ethyl, 2-(1-Methylethoxy)ethyl, 2-(n-Butoxy)ethyl, 2-(1-Methylpropoxy)ethyl, 2-(2-Methylpropoxy)ethyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)ethyl, 2-(Methoxy)propyl, 2-(Ethoxy)propyl, 2-(n-Propoxy)propyl, 2-(1-Methylethoxy)propyl, 2-(n-Butoxy)propyl, 2-(1-Methylpropoxy)propyl, 2-(2-Methylpropoxy)propyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)propyl, 3-(Methoxy)propyl, 3-(Ethoxy)propyl, 3-(n-Propoxy)propyl, 3-(1-Methylethoxy)propyl, 3-(n-Butoxy)propyl, 3-(1-Methylpropoxy)propyl, 3-(2-Methylpropoxy)propyl, 3-(1,1-Dimethylethoxy)propyl, 2-(Methoxy)butyl, 2-(Ethoxy)butyl, 2-(n-Propoxy)butyl, 2-(1-Methylethoxy)butyl, 2-(n-Butoxy)butyl, 2-(1-Methylpropoxy)butyl, 2-(2-Methylpropoxy)butyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)butyl, 3-(Methoxy)butyl, 3-(Ethoxy)butyl, 3-(n-Propoxy)butyl, 3-(1-Methylethoxy)butyl, 3-(n-Butoxy)butyl, 3-(1-Methylpropoxy)butyl, 3-(2-Methylpropoxy)butyl, 3-(1,1-Dimethylethoxy)butyl, 4-(Methoxy)butyl, 4-(Ethoxy)butyl, 4-(n-Propoxy)butyl, 4-(1-Methylethoxy)butyl, 4-(n-Butoxy)butyl, 4-(1-Methylpropoxy)butyl, 4-(2-Methylpropoxy)butyl oder 4-(1,1-Dimethylethoxy)butyl;
- C₁-C₄-Alkylthio für: z. B. SCH₃, SC₂H₅, SCH₂-C₂H₅, SCH(CH₃)₂, n-Butylthio, SCH(CH₃)-C₂H₅, SCH₂-CH(CH₃)₂ oder SC(CH₃)₃;
- C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl für: durch C₁-C₄-Alkylthio - wie vorstehend genannt - substituiertes C₁-C₄-Alkyl, also z.B. für CH₂-SCH₃, CH₂-SC₂H₅, n-Propylthiomethyl, CH₂-SCH(CH₃)₂, n-Butylthiomethyl, (1-Methylpropylthio)methyl, (2-Methylpropylthio)methyl, CH₂-SC(CH₃)₃, 2-(Methylthio)ethyl, 2-(Ethylthio)ethyl, 2-(n-Propylthio)ethyl, 2-(1-Methylethylthio)ethyl, 2-(n-Butylthio)ethyl, 2-(1-Methylpropylthio)ethyl, 2-(2-Methylpropylthio)ethyl, 2-(1,1-Dimethylethylthio)ethyl, 2-(Methylthio)propyl, 2-(Ethylthio)propyl, 2-(n-Propylthio)propyl, 2-(1-Methylethylthio)propyl, 2-(n-Butylthio)propyl, 2-(1-Methylpropylthio)propyl, 2-(2-Methylpropylthio)propyl, 2-(1,1-Dimethylethylthio)propyl, 3-(Methylthio)propyl, 3-(Ethylthio)propyl, 3-(n-Propylthio)propyl, 3-(1-Methylethylthio)propyl, 3-(n-Butylthio)propyl, 3-(1-Methylpropylthio)propyl, 3-(2-Methylpropylthio)propyl, 3-(1,1-Dimethylethylthio)propyl, 2-(Methylthio)butyl,

- 2-(Ethylthio)butyl, 2-(n-Propylthio)butyl,
2-(1-Methylethylthio)butyl, 2-(n-Butylthio)butyl,
2-(1-Methylpropylthio)butyl, 2-(2-Methylpropylthio)butyl,
2-(1,1-Dimethylethylthio)butyl, 3-(Methylthio)butyl,
5 3-(Ethylthio)butyl, 3-(n-Propylthio)butyl,
3-(1-Methylethylthio)butyl, 3-(n-Butylthio)butyl,
3-(1-Methylpropylthio)butyl, 3-(2-Methylpropylthio)butyl,
3-(1,1-Dimethylethylthio)butyl, 4-(Methylthio)butyl,
4-(Ethylthio)butyl, 4-(n-Propylthio)butyl,
10 4-(1-Methylethylthio)butyl, 4-(n-Butylthio)butyl,
4-(1-Methylpropylthio)butyl, 4-(2-Methylpropylthio)butyl oder
4-(1,1-Dimethylethylthio)butyl;
- C₁-C₄-Alkylsulfinyl (C₁-C₄-Alkyl-S(=O)-) sowie die Alkylsulfi-
15 nylteile von C₁-C₄-Alkylsulfinyl-C₁-C₄-Alkyl für: z.B.
Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Propylsulfinyl,
1-Methylethylsulfinyl, Butylsulfinyl, 1-Methylpropylsulfinyl,
2-Methylpropylsulfinyl oder 1,1-Dimethylethylsulfinyl;
- 20 — C₁-C₄-Alkylsulfonyl (C₁-C₄-Alkyl-S(=O)₂-) sowie die Alkylsul-
fonylteile von C₁-C₄-Alkylsulfonyl-C₁-C₄-Alkyl für: z. B.
Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Propylsulfonyl,
1-Methylethylsulfonyl, Butylsulfonyl, 1-Methylpropylsulfonyl,
2-Methylpropylsulfonyl oder 1,1-Dimethylethylsulfonyl, vor-
25 zugsweise Methylsulfonyl;
- C₁-C₄-Alkylsulfonyloxy für: z. B. Methylsulfonyloxy,
Ethylsulfonyloxy, n-Propylsulfonyloxy, 1-Methylethylsulfony-
loxy, Butylsulfonyloxy, 1-Methylpropylsulfonyloxy,
30 2-Methylpropylsulfonyloxy oder 1,1-Dimethylethylsulfonyloxy,
vorzugsweise Methylsulfonyloxy;
- Cyano-C₁-C₄-alkyl für: z. B. CH₂CN, 1-Cyanoethyl,
2-Cyanoethyl, 1-Cyanoprop-1-yl, 2-Cyanoprop-1-yl, 3-Cyano-
35 prop-1-yl, 1-Cyanobut-1-yl, 2-Cyanobut-1-yl, 3-Cyanobut-1-yl,
4-Cyanobut-1-yl, 1-Cyanobut-2-yl, 2-Cyanobut-2-yl,
3-Cyanobut-2-yl, 4-Cyanobut-2-yl, 1-(CH₂CN)eth-1-yl,
1-(CH₂CN)-1-(CH₃)eth-1-yl oder 1-(CH₂CN)prop-1-yl;
- 40 — Phenyl-C₁-C₄-alkyl für: z. B. Benzyl, 1-Phenylethyl,
2-Phenylethyl, 1-Phenylprop-1-yl, 2-Phenylprop-1-yl,
3-Phenylprop-1-yl, 1-Phenylbut-1-yl, 2-Phenylbut-1-yl,
3-Phenylbut-1-yl, 4-Phenylbut-1-yl, 1-Phenylbut-2-yl,
2-Phenylbut-2-yl, 3-Phenylbut-2-yl, 4-Phenylbut-2-yl,
45 1-(Benzyl)eth-1-yl, 1-(Benzyl)-1-(methyl)eth-1-yl oder
1-(Benzyl)prop-1-yl;

10

- C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl für: z.B. Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Propoxycarbonyl, 1-Methylethoxycarbonyl, Butoxycarbonyl, 1-Methylpropoxycarbonyl, 2-Methylpropoxycarbonyl oder 1,1-Dimethylethoxycarbonyl;
- 5 - (C₁-C₄-Alkoxy)-carbonyl-C₁-C₄-alkyl für: durch (C₁-C₄-Alkoxy)-carbonyl - wie vorstehend genannt - substituiertes C₁-C₄-Alkyl, also z.B. für CH₂-CO-OCH₃, CH₂-CO-OC₂H₅, CH₂-CO-OCH₂-C₂H₅, CH₂-CO-OCH(CH₃)₂, n-Butoxycarbonylmethyl, 10 CH₂-CO-OCH(CH₃)-C₂H₅, CH₂-CO-OCH₂-CH(CH₃)₂, CH₂-CO-OC(CH₃)₃, 1-(CO-OCH₃)ethyl, 1-(CO-OC₂H₅)ethyl, 1-(CO-OCH₂-C₂H₅)ethyl, 1-[CH(CH₃)₂]ethyl, 1-(n-Butoxycarbonyl)ethyl, 1-[1-Methylpropoxycarbonyl]ethyl, 1-[2-Methylpropoxycarbonyl]ethyl, 2-(CO-OCH₃)ethyl, 15 2-(CO-OC₂H₅)ethyl, 2-(CO-OCH₂-C₂H₅)ethyl, 2-[CO-OCH(CH₃)₂]ethyl, 2-(n-Butoxycarbonyl)ethyl, 2-[1-Methylpropoxycarbonyl]ethyl, 2-[2-Methylpropoxycarbonyl]ethyl, 2-[CO-OC(CH₃)₃]ethyl, 2-(CO-OCH₃)propyl, 2-(CO-OC₂H₅)propyl, 2-(CO-OCH₂-C₂H₅)propyl, 20 2-[CO-OCH(CH₃)₂]propyl, 2-(n-Butoxycarbonyl)propyl, 2-[1-Methylpropoxycarbonyl]propyl, 2-[2-Methylpropoxycarbonyl]propyl, 2-[CO-OC(CH₃)₃]propyl, 3-(CO-OCH₃)propyl, 3-(CO-OC₂H₅)propyl, 3-(CO-OCH₂-C₂H₅)propyl, 3-[CO-OCH(CH₃)₂]propyl, 3-(n-Butoxycarbonyl)propyl, 25 3-[1-Methylpropoxycarbonyl]propyl, 3-[2-Methylpropoxycarbonyl]propyl, 3-[CO-OC(CH₃)₃]propyl, 2-(CO-OCH₃)butyl, 2-(CO-OC₂H₅)butyl, 2-(CO-OCH₂-C₂H₅)butyl, 2-[CO-OCH(CH₃)₂]butyl, 2-(n-Butoxycarbonyl)butyl, 2-[1-Methylpropoxycarbonyl]butyl, 30 2-[2-Methylpropoxycarbonyl]butyl, 2-[CO-OC(CH₃)₃]butyl, 3-(CO-OCH₃)butyl, 3-(CO-OC₂H₅)butyl, 3-(CO-OCH₂-C₂H₅)butyl, 3-[CO-OCH(CH₃)₂]butyl, 3-(n-Butoxycarbonyl)butyl, 3-[1-Methylpropoxycarbonyl]butyl, 3-[2-Methylpropoxycarbonyl]butyl, 3-[CO-OC(CH₃)₃]butyl, 35 4-(CO-OCH₃)butyl, 4-(CO-OC₂H₅)butyl, 4-(CO-OCH₂-C₂H₅)butyl, 4-[CO-OCH(CH₃)₂]butyl, 4-(n-Butoxycarbonyl)butyl, 4-[1-Methylpropoxycarbonyl]butyl, 4-[2-Methylpropoxycarbonyl]butyl oder 4-[CO-OC(CH₃)₃]butyl, vorzugsweise für CH₂-CO-OCH₃, 40 CH₂-CO-OC₂H₅, 1-(CO-OCH₃)ethyl oder 1-(CO-OC₂H₅)ethyl;
- Amino-C₁-C₄-alkyl für: z. B. CH₂NH₂, 1-Aminoethyl, 2-Aminoethyl, 1-Aminoprop-1-yl, 2-Aminoprop-1-yl, 3-Aminoprop-1-yl, 1-Aminobut-1-yl, 2-Aminobut-1-yl, 45 3-Aminobut-1-yl, 4-Aminobut-1-yl, 1-Aminobut-2-yl, 2-Aminobut-2-yl, 3-Aminobut-2-yl, 4-Aminobut-2-yl,

11

1-(CH₂NH₂)eth-1-yl, 1-(CH₂NH₂)-1-(CH₃)eth-1-yl oder
1-(CH₂NH₂)prop-1-yl;

- C₁-C₄-Alkylamino für: z. B. H₃C-NH-, H₅C₂-NH-, n-Propyl-NH-,
5 1-Methylethyl-NH-, n-Butyl-NH-, 1-Methylpropyl-NH-, 2-Methyl-
propyl-NH- oder 1,1-Dimethylethyl-NH-;
- C₁-C₄-Alkylamino-C₁-C₄-alkyl für: durch C₁-C₄-Alkylamino
wie vorstehend definiert, substituiertes C₁-C₄-Alkyl, also
10 beispielsweise für CH₂CH₂-NH-CH₃, CH₂CH₂-N(CH₃)₂,
CH₂CH₂-NH-C₂H₅ oder CH₂CH₂-N(C₂H₅)₂;
- Di(C₁-C₄-alkyl)amino für: N(CH₃)₂, N(C₂H₅)₂, N,N-Dipropylamino,
N,N-Di-(1-methylethyl)amino, N,N-Dibutylamino,
15 N,N-Di-(1-methylpropyl)amino, N,N-Di-(2-methylpropyl)amino,
N,N-Di-(1,1-dimethylethyl)amino, N-Ethyl-N-methylamino,
N-Methyl-N-propylamino, N-Methyl-N-(1-methylethyl)amino,
N-Butyl-N-methylamino, N-Methyl-N-(1-methylpropyl)amino,
N-Methyl-N-(2-methylpropyl)amino,
20 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methylamino, N-Ethyl-N-propylamino,
N-Ethyl-N-(1-methylethyl)amino, N-Butyl-N-ethylamino,
N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)amino,
N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)amino,
N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino,
25 N-(1-Methylethyl)-N-propylamino,
N-Butyl-N-propylamino, N-(1-Methylpropyl)-N-propylamino,
N-(2-Methylpropyl)-N-propylamino,
N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylamino,
N-Butyl-N-(1-methylethyl)amino,
30 N-(1-Methylethyl)-N-(1-methylpropyl)amino,
N-(1-Methylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino,
N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)amino,
N-Butyl-N-(1-methylpropyl)amino,
N-Butyl-N-(2-methylpropyl)amino,
35 N-Butyl-N-(1,1-dimethylethyl)-
amino, N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)amino,
N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylpropyl)amino oder
N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino;
- 40 - Di(C₁-C₄-alkyl)amino-C₁-C₄-alkyl für: durch
Di(C₁-C₄-alkyl)amino wie vorstehend genannt substituiertes
C₁-C₄-Alkyl, also z.B. für CH₂N(CH₃)₂, CH₂N(C₂H₅)₂,
N,N-Dipropylaminomethyl, N,N-Di[CH(CH₃)₂]aminomethyl,
N,N-Dibutylaminomethyl, N,N-Di-(1-methylpropyl)aminomethyl,
45 N,N-Di-(2-methylpropyl)aminomethyl, N,N-Di[C(CH₃)₃]aminomethyl,
N-Ethyl-N-methylaminomethyl, N-Methyl-N-propylaminomethyl,
N-Methyl-N-[CH(CH₃)₂]aminomethyl,

- N-Butyl-N-methylaminomethyl,
N-Methyl-N-(1-methylpropyl)aminomethyl,
N-Methyl-N-(2-methylpropyl)aminomethyl,
N-[C(CH₃)₃]-N-methylaminomethyl, N-Ethyl-N-propylaminomethyl,
5 N-Ethyl-N-[CH(CH₃)₂]aminomethyl, N-Butyl-N-ethylaminomethyl,
N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)aminomethyl,
N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)aminomethyl,
N-Ethyl-N-[C(CH₃)₃]aminomethyl,
N-[CH(CH₃)₂]-N-propylaminomethyl,
10 N-Butyl-N-propylaminomethyl,
N-(1-Methylpropyl)-N-propylaminomethyl,
N-(2-Methylpropyl)-N-propylaminomethyl,
N-[C(CH₃)₃]-N-propylaminomethyl,
N-Butyl-N-(1-methylethyl)-aminomethyl,
15 N-[CH(CH₃)₂]-N-(1-methylpropyl)aminomethyl,
N-[CH(CH₃)₂]-N-(2-methylpropyl)aminomethyl,
N-[C(CH₃)₃]-N-[CH(CH₃)₂]aminomethyl,
N-Butyl-N-(1-methylpropyl)aminomethyl,
N-Butyl-N-(2-methylpropyl)aminomethyl,
20 N-Butyl-N-[C(CH₃)₃]aminomethyl,
N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)aminomethyl,
N-[C(CH₃)₃]-N-(1-methylpropyl)aminomethyl,
N-[C(CH₃)₃]-N-(2-methylpropyl)aminomethyl,
N,N-Dimethylaminoethyl, N,N-Diethylaminoethyl,
25 N,N-Di(n-propyl)aminoethyl,
N,N-Di-[CH(CH₃)₂]-aminoethyl, N,N-Dibutylaminoethyl,
N,N-Di(1-methylpropyl)aminoethyl,
N,N-Di(2-methylpropyl)aminoethyl,
N,N-Di-[C(CH₃)₃]aminoethyl, N-Ethyl-N-methylaminoethyl,
30 N-Methyl-N-propylaminoethyl, N-Methyl-N-[CH(CH₃)₂]aminoethyl,
N-Butyl-N-methylaminoethyl, N-Methyl-N-(1-methylpropyl)aminoethyl,
N-Methyl-N-(2-methylpropyl)aminoethyl,
N-[C(CH₃)₃]-N-methylaminoethyl, N-Ethyl-N-propylaminoethyl,
N-Ethyl-N-[CH(CH₃)₂]aminoethyl, N-Butyl-N-ethylaminoethyl,
35 N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)aminoethyl,
N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)aminoethyl,
N-Ethyl-N-[C(CH₃)₃]aminoethyl,
N-[CH(CH₃)₂]-N-propylaminoethyl, N-Butyl-N-propylaminoethyl,
N-(1-Methylpropyl)-N-propylaminoethyl,
40 N-(2-Methylpropyl)-N-propylaminoethyl,
N-[C(CH₃)₃]-N-propylaminoethyl,
N-Butyl-N-[CH(CH₃)₂]aminoethyl,
N-[CH(CH₃)₂]-N-(1-methylpropyl)aminoethyl,
N-[CH(CH₃)₂]-N-(2-methylpropyl)aminoethyl,
45 N-[C(CH₃)₃]-N-[CH(CH₃)₂]aminoethyl,
N-Butyl-N-(1-methylpropyl)aminoethyl,
N-Butyl-N-(2-methylpropyl)aminoethyl,

13

N-Butyl-N-[C(CH₃)₃]aminoethyl,
 N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)aminoethyl,
 N-[C(CH₃)₃]-N-(1-methylpropyl)aminoethyl oder
 N-[C(CH₃)₃]-N-(2-methylpropyl)aminoethyl;

- 5
- Aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl für: z. B. CH₂CONH₂, 1-(CONH₂)ethyl,
 2-(CONH₂)ethyl, 1-(CONH₂)prop-1-yl, 2-(CONH₂)prop-1-yl,
 3-(CONH₂)prop-1-yl, 1-(CONH₂)but-1-yl, 2-(CONH₂)but-1-yl,
 3-(CONH₂)but-1-yl, 4-(CONH₂)but-1-yl, 1-(CONH₂)but-2-yl,
 10 2-(CONH₂)but-2-yl, 3-(CONH₂)but-2-yl, 4-(CONH₂)but-2-yl,
 1-(CH₂CONH₂)eth-1-yl, 1-(CH₂CONH₂)-1-(CH₃)-eth-1-yl oder
 1-(CH₂CONH₂)prop-1-yl;
- (C₁-C₄-Alkylamino)carbonyl-C₁-C₄-alkyl für: durch
 15 (C₁-C₄-Alkylamino)carbonyl wie vorstehend genannt, substi-
 tuiertes C₁-C₄-Alkyl, also z.B. für
 CH₂-CO-NH-CH₃, CH₂-CO-NH-C₂H₅, CH₂-CO-NH-CH₂-C₂H₅,
 CH₂-CO-NH-CH(CH₃)₂, CH₂-CO-NH-CH₂CH₂-C₂H₅,
 CH₂-CO-NH-CH(CH₃)-C₂H₅, CH₂-CO-NH-CH₂-CH(CH₃)₂,
 20 CH₂-CO-NH-C(CH₃)₃, CH(CH₃)-CO-NH-CH₃, CH(CH₃)-CO-NH-C₂H₅,
 2-(CO-NH-CH₃)ethyl, 2-(CO-NH-C₂H₅)ethyl,
 2-(CO-NH-CH₂-C₂H₅)ethyl, 2-[CH₂-CO-NH-CH(CH₃)₂]ethyl,
 2-(CO-NH-CH₂CH₂-C₂H₅)ethyl, 2-[CO-NH-CH(CH₃)-C₂H₅]ethyl,
 2-[CO-NH-CH₂-CH(CH₃)₂]ethyl, 2-[CO-NH-C(CH₃)₃]ethyl,
 25 2-(CO-NH-CH₃)propyl, 2-(CO-NH-C₂H₅)propyl,
 2-(CO-NH-CH₂-C₂H₅)propyl, 2-[CH₂-CO-NH-CH(CH₃)₂]propyl,
 2-(CO-NH-CH₂CH₂-C₂H₅)propyl, 2-[CO-NH-CH(CH₃)-C₂H₅]propyl,
 2-[CO-NH-CH₂-CH(CH₃)₂]propyl, 2-[CO-NH-C(CH₃)₃]propyl,
 3-(CO-NH-CH₃)propyl, 3-(CO-NH-C₂H₅)propyl,
 30 3-(CO-NH-CH₂-C₂H₅)propyl, 3-[CH₂-CO-NH-CH(CH₃)₂]propyl,
 3-(CO-NH-CH₂CH₂-C₂H₅)propyl, 3-[CO-NH-CH(CH₃)-C₂H₅]propyl,
 3-[CO-NH-CH₂-CH(CH₃)₂]propyl, 3-[CO-NH-C(CH₃)₃]propyl,
 2-(CO-NH-CH₃)butyl, 2-(CO-NH-C₂H₅)butyl,
 2-(CO-NH-CH₂-C₂H₅)butyl, 2-[CH₂-CO-NH-CH(CH₃)₂]butyl,
 35 2-(CO-NH-CH₂CH₂-C₂H₅)butyl, 2-[CO-NH-CH(CH₃)-C₂H₅]butyl,
 2-[CO-NH-CH₂-CH(CH₃)₂]butyl, 2-[CO-NH-C(CH₃)₃]butyl,
 3-(CO-NH-CH₃)butyl, 3-(CO-NH-C₂H₅)butyl,
 3-(CO-NH-CH₂-C₂H₅)butyl, 3-[CH₂-CO-NH-CH(CH₃)₂]butyl,
 3-(CO-NH-CH₂CH₂-C₂H₅)butyl, 3-[CO-NH-CH(CH₃)-C₂H₅]butyl,
 40 3-[CO-NH-CH₂-CH(CH₃)₂]butyl, 3-[CO-NH-C(CH₃)₃]butyl,
 4-(CO-NH-CH₃)butyl, 4-(CO-NH-C₂H₅)butyl,
 4-(CO-NH-CH₂-C₂H₅)butyl, 4-[CH₂-CO-NH-CH(CH₃)₂]butyl,
 4-(CO-NH-CH₂CH₂-C₂H₅)butyl, 4-[CO-NH-CH(CH₃)-C₂H₅]butyl,
 4-[CO-NH-CH₂-CH(CH₃)₂]butyl oder 4-[CO-NH-C(CH₃)₃]butyl;
- 45

- Di-(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl für: durch
Di(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl - wie vorstehend genannt -substituiertes C₁-C₄-Alkyl, also z.B.
Di-(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonylmethyl,
5 1- oder 2-Di-(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonylethyl,
1-, 2- oder 3-Di-(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonylpropyl;

- C₁-C₄-Alkylphenyl für: durch C₁-C₄-Alkyl - wie vorstehend genannt - substituiertes Phenyl, also z. B. für 2-Tolyl,
10 3-Tolyl, 4-Tolyl, 2-Ethylphenyl, 3-Ethylphenyl,
4-Ethylphenyl, 2-(n-Propyl)phenyl, 3-(n-Propyl)phenyl,
4-(n-Propyl)phenyl, 2-(1-Methylethyl)phenyl,
3-(1-Methylethyl)phenyl, 4-(1-Methylethyl)phenyl,
2-(n-Butyl)phenyl, 3-(n-Butyl)phenyl, 4-(n-Butyl)phenyl,
15 2-(1-Methylpropyl)phenyl, 3-(1-Methylpropyl)phenyl,
4-(1-Methylpropyl)phenyl, 2-(2-Methylpropyl)phenyl, 3-(2-Methylpropyl)phenyl, 4-(2-Methylpropyl)phenyl,
2-(1,1-Dimethyl)phenyl, 3-(1,1-Dimethyl)phenyl,
4-(1,1-Dimethyl)phenyl;

- C₃-C₆-Alkenyl für: einen einfach ungesättigten aliphatischen Kohlenwasserstoffrest mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, der vorzugsweise nicht über ein olefinisches C-Atom gebunden ist,
z. B. Prop-1-en-1-yl, Prop-2-en-1-yl, 1-Methylethenyl,
25 Buten-1-yl, Buten-2-yl, Buten-3-yl, 1-Methyl-prop-1-en-1-yl,
2-Methyl-prop-1-en-1-yl, 1-Methyl-prop-2-en-1-yl,
2-Methyl-prop-2-en-1-yl, Penten-1-yl, Penten-2-yl,
Penten-3-yl, Penten-4-yl,
1-Methyl-but-1-en-1-yl, 2-Methyl-but-1-en-1-yl,
30 3-Methyl-but-1-en-1-yl, 1-Methyl-but-2-en-1-yl,
2-Methyl-but-2-en-1-yl, 3-Methyl-but-2-en-1-yl,
1-Methyl-but-3-en-1-yl, 2-Methyl-but-3-en-1-yl,
3-Methyl-but-3-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-prop-2-en-1-yl,
1,2-Dimethyl-prop-1-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-prop-2-en-1-yl,
35 1-Ethyl-prop-1-en-2-yl, 1-Ethyl-prop-2-en-1-yl,
Hex-1-en-1-yl, Hex-2-en-1-yl, Hex-3-en-1-yl, Hex-4-en-1-yl,
Hex-5-en-1-yl, 1-Methyl-pent-1-en-1-yl,
2-Methyl-pent-1-en-1-yl, 3-Methyl-pent-1-en-1-yl,
4-Methyl-pent-1-en-1-yl, 1-Methyl-pent-2-en-1-yl,
40 2-Methyl-pent-2-en-1-yl, 3-Methyl-pent-2-en-1-yl,
4-Methyl-pent-2-en-1-yl, 1-Methyl-pent-3-en-1-yl,
2-Methyl-pent-3-en-1-yl, 3-Methyl-pent-3-en-1-yl,
4-Methyl-pent-3-en-1-yl, 1-Methyl-pent-4-en-1-yl,
2-Methyl-pent-4-en-1-yl, 3-Methyl-pent-4-en-1-yl,
45 4-Methyl-pent-4-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-but-2-en-1-yl,
1,1-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-but-1-en-1-yl,
1,2-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-but-3-en-1-yl,

15

- 1,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl, 1,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl,
1,3-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 2,2-Dimethyl-but-3-en-1-yl,
2,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl, 2,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl,
2,3-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 3,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl,
5 3,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1-Ethyl-but-1-en-1-yl,
1-Ethyl-but-2-en-1-yl, 1-Ethyl-but-3-en-1-yl,
2-Ethyl-but-1-en-1-yl, 2-Ethyl-but-2-en-1-yl,
2-Ethyl-but-3-en-1-yl, 1,1,2-Trimethyl-prop-2-en-1-yl,
1-Ethyl-1-methyl-prop-2-en-1-yl,
10 1-Ethyl-2-methyl-prop-1-en-1-yl oder
1-Ethyl-2-methyl-prop-2-en-1-yl;
- C₃-C₆-Alkynyl für: einen eine Dreifachbindung enthaltenden
aliphatischen Kohlenwasserstoffrest mit 3 bis 6 Kohlenstoff-
15 atomen, der vorzugsweise nicht über ein C-Atom der Dreifach-
bindung gebunden ist, z. B. Propargyl (2-Propinyl),
1-Propinyl, But-1-in-3-yl, But-1-in-4-yl, But-2-in-1-yl,
Pent-1-in-3-yl, Pent-1-in-4-yl, Pent-1-in-5-yl,
Pent-2-in-1-yl, Pent-2-in-4-yl, Pent-2-in-5-yl,
20 3-Methyl-but-1-in-3-yl, 3-Methyl-but-1-in-4-yl,
Hex-1-in-3-yl, Hex-1-in-4-yl, Hex-1-in-5-yl, Hex-1-in-6-yl,
Hex-2-in-1-yl, Hex-2-in-4-yl, Hex-2-in-5-yl, Hex-2-in-6-yl,
Hex-3-in-1-yl, Hex-3-in-2-yl, 3-Methyl-pent-1-in-3-yl,
3-Methyl-pent-1-in-4-yl, 3-Methyl-pent-1-in-5-yl,
25 4-Methyl-pent-2-in-4-yl oder 4-Methyl-pent-2-in-5-yl.

Im Hinblick auf die Verwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen
der Formel I als Herbizide und/oder als desikkant/defoliant wirk-
same Verbindungen haben die Variablen X, R² bis R⁶ vorzugsweise
30 die folgenden Bedeutungen, und zwar unabhängig voneinander und
insbesondere in Kombination:

- X Sauerstoff,
R² Wasserstoff, Fluor oder Chlor,
R³ Chlor oder Cyano, insbesondere Chlor,
35 R⁴, R⁵ unabhängig voneinander Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl, insbe-
sondere Wasserstoff oder Methyl,
R⁶ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl, insbesondere Wasserstoff oder
Methyl.

40 In einer bevorzugten Ausführungsform der Erfindung steht R⁴ oder
R⁵ für Wasserstoff und der andere Rest R⁴ oder R⁵ für C₁-C₄-Alkyl,
insbesondere Methyl oder R⁴, R⁵ stehen jeweils für Methyl.

Ganz besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I, wo-
45 rin die Variablen

R² für Wasserstoff, Chlor oder Fluor,

R³ für Chlor oder Cyano,
R⁶ für Wasserstoff und
X für Sauerstoff

5 stehen.

Folgende Ausführungsformen der 3-Heterocyclyl substituierten Benzoesäure-Derivate der allgemeinen Formel I sind hervorzuheben:

- 10 1. In einer besonders bevorzugten Ausführungsform steht R¹ in Formel I für einen heterocyclischen Rest der Formel II-A. Derartige Verbindungen werden im Folgenden auch als Verbindungen I-A bezeichnet. In den Verbindungen I-A haben X, R² bis R⁸ vorzugsweise die als bevorzugt und insbesondere die
15 als besonders bevorzugt angegebenen Bedeutungen. Insbesondere stehen in Formel II-A:
R¹⁰ für C₁-C₄-Alkyl oder Amino, insbesondere für Methyl oder Amino,
R¹¹ für C₁-C₄-Halogenalkyl, insbesondere für Trifluormethyl,
20 und
R¹² für Wasserstoff.
2. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform steht R¹ in Formel I für einen heterocyclischen Rest der Formel II-B.
25 Derartige Verbindungen werden im Folgenden auch als Verbindungen I-B bezeichnet. In den Verbindungen I-B haben X, R² bis R⁸ vorzugsweise die als bevorzugt und insbesondere die als besonders bevorzugt angegebenen Bedeutungen. Insbesondere stehen in Formel II-B
30 R¹³, R^{13'} jeweils unabhängig voneinander für C₁-C₄-Alkyl, insbesondere für Methyl.
3. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform steht R¹ in Formel I für einen heterocyclischen Rest der Formel II-C.
35 Derartige Verbindungen werden im Folgenden auch als Verbindungen I-C bezeichnet. In den Verbindungen I-C haben X, R² bis R⁸ vorzugsweise die als bevorzugt und insbesondere die als besonders bevorzugt angegebenen Bedeutungen. Insbesondere stehen in Formel II-C:
40 R¹⁴ für Fluor oder Chlor, insbesondere für Chlor,
R¹⁵ für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl, insbesondere für Wasserstoff,
R¹⁶ für C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyloxy, insbesondere für Trifluormethyl, Methylsulfonyl oder Methylsulfonyloxy.
45

4. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform steht R^1 in Formel I für einen heterocyclischen Rest der Formel II-D. Derartige Verbindungen werden im Folgenden auch als Verbindungen I-D bezeichnet. In den Verbindungen I-D haben X, R^2 bis R^8 vorzugsweise die als bevorzugt und insbesondere die als besonders bevorzugt angegebenen Bedeutungen. Insbesondere stehen in Formel II-D:
- 5 R^{18} für Wasserstoff, Methyl oder Amino,
10 R^{19} für C_1 - C_4 -Halogenalkyl oder C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl, insbesondere für Trifluormethyl oder Methylsulfonyl,
 R^{20} für Wasserstoff.
5. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform steht R^1 in Formel I für einen heterocyclischen Rest der Formel II-E. Derartige Verbindungen werden im Folgenden auch als Verbindungen I-E bezeichnet. In den Verbindungen I-E haben X, R^2 bis R^8 vorzugsweise die als bevorzugt und insbesondere die als besonders bevorzugt angegebenen Bedeutungen. Insbesondere stehen in Formel II-E:
- 15 R^{21} für Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl, insbesondere für Chlor oder Brom,
20 R^{22} für C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy oder C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl, insbesondere für Trifluormethyl, Difluormethyloxy oder Methylsulfonyl,
25 R^{23} für C_1 - C_4 -Alkyl, insbesondere für Methyl.
6. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform steht R^1 in Formel I für einen heterocyclischen Rest der Formel II-F. Derartige Verbindungen werden im Folgenden auch als Verbindungen I-F bezeichnet. In den Verbindungen I-F haben X, R^2 bis R^8 vorzugsweise die als bevorzugt und insbesondere die als besonders bevorzugt angegebenen Bedeutungen. Insbesondere stehen in Formel II-F:
- 30 R^{24} für Wasserstoff, Methyl, Difluormethyl oder Trifluormethyl,
35 R^{25} für Methyl oder Trifluormethyl, oder
 R^{24} und R^{25} zusammen für eine Kette der Formel $-(CH_2)_4-$.
- 40 7. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform steht R^1 in Formel I für einen heterocyclischen Rest der Formel II-G. Derartige Verbindungen werden im Folgenden auch als Verbindungen I-G bezeichnet. In den Verbindungen I-G haben X, R^2 bis R^8 vorzugsweise die als bevorzugt und insbesondere die als besonders bevorzugt angegebenen Bedeutungen. Insbesondere stehen in Formel II-G:
- 45

A¹, A² jeweils für Sauerstoff.

8. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform steht R¹ in Formel I für einen heterocyclischen Rest der Formel II-H.
- 5 Derartige Verbindungen werden im Folgenden auch als Verbindungen I-H bezeichnet. In den Verbindungen I-H haben X, R² bis R⁸ vorzugsweise die als bevorzugt und insbesondere die als besonders bevorzugt angegebenen Bedeutungen. Insbesondere stehen in Formel II-H:
- 10 A³, A⁴ wie vorgenannt, vorzugsweise jeweils für Sauerstoff, R²⁶, R²⁷ jeweils unabhängig voneinander für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl, insbesondere für Methyl oder Difluormethyl oder Trifluormethyl oder
- R²⁶ und R²⁷ zusammen für eine Kette der Formel -CH₂-O-(CH₂)₂- oder -(CH₂)₄.
- 15

Ganz besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I, worin die Variablen

- R¹ für II-A mit R¹⁰ = CH₃ oder Amino, R¹¹ = CF₃ und
- 20 R¹² = Wasserstoff,
- R² für Wasserstoff oder Fluor,
- R³ für Chlor oder Cyano,
- R⁶ für Wasserstoff und
- X für Sauerstoff
- 25 stehen.

- Ganz besonders bevorzugt sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Aa (≡ I mit R¹ = II-A, R¹⁰ = Methyl, R¹¹ = Trifluormethyl und R¹² = Wasserstoff, R² = F; R³ =
- 30 Cl; R⁶ = H, X = O), worin R⁴, R⁵, R⁷ und R⁸ die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Aa.1 bis I-Aa.600, in denen die Variablen R⁴, R⁵, R⁷ und R⁸ gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeu-
- 35 tungen aufweisen.

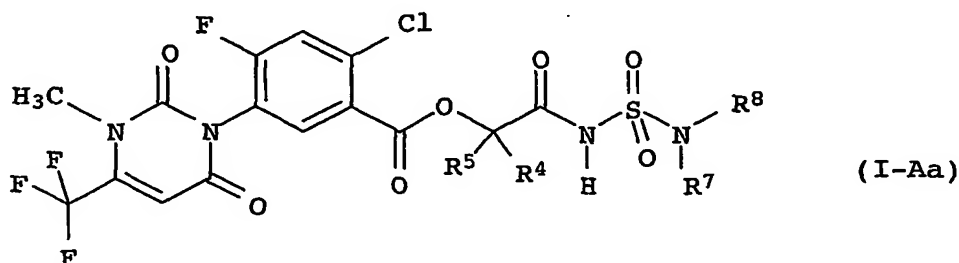


Tabelle 1:

	Nr.	R ⁴	R ⁵	R ⁷	R ⁸
5	1	H	H	H	H
	2	H	H	H	CH ₃
	3	H	H	H	CH ₂ CH ₃
	4	H	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃
10	5	H	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
	6	H	H	H	CH(CH ₃) ₂
	7	H	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	8	H	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
15	9	H	H	H	C(CH ₃) ₃
	10	H	H	H	CH ₂ OCH ₃
	11	H	H	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	12	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
20	13	H	H	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	14	H	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
	15	H	H	H	CH ₂ CH ₂ Cl
	16	H	H	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
25	17	H	H	H	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃
	18	H	H	H	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃
	19	H	H	H	CH ₂ CH ₂ CN
	20	H	H	H	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
30	21	H	H	H	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
	22	H	H	H	CH ₂ CH ₂ NH ₂
	23	H	H	H	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
	24	H	H	H	CH ₂ CH ₂ N(CH ₂ CH ₃) ₂
35	25	H	H	H	CH ₂ CH=CH ₂
	26	H	H	H	C(CH ₃)=CH ₂
	27	H	H	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
	28	H	H	H	C(CH ₃)CH=CHCH ₃
40	29	H	H	H	CH ₂ C≡CH
	30	H	H	H	CH(CH ₃)C≡CH
	31	H	H	H	CH ₂ C≡CHCH ₃
	32	H	H	H	Ph
45	33	H	H		-(CH ₂) ₄ -
	34	H	H		-(CH ₂) ₅ -
	35	H	H		-(CH ₂) ₂ NH(CH ₂) ₂ -
	36	H	H		-(CH ₂) ₂ NCH ₃ (CH ₂) ₂ -
46	37	H	H		-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -
	38	H	H		-CH ₂ CH=CHCH ₂ -
	39	H	H		-CH ₂ CH=CHCH ₂ CH ₂ -
	40	H	H		-CH=CHCH ₂ CH ₂ CH ₂ -
45	41	H	H	CH ₃	H
	42	H	H	CH ₃	CH ₃
	43	H	H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
	44	H	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
	45	H	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
	46	H	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂

	Nr.	R ⁴	R ⁵	R ⁷	R ⁸
5	47	H	H	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	48	H	H	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
	49	H	H	CH ₃	C(CH ₃) ₃
	50	H	H	CH ₃	CH ₂ OCH ₃
	51	H	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
10	52	H	H	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	53	H	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	54	H	H	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
	55	H	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ Cl
	56	H	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
15	57	H	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃
	58	H	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃
	59	H	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN
	60	H	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
	61	H	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
20	62	H	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ NH ₂
	63	H	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
	64	H	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₂ CH ₃) ₂
	65	H	H	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
	66	H	H	CH ₃	C(CH ₃)=CH ₂
25	67	H	H	CH ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃
	68	H	H	CH ₃	C(CH ₃)CH=CHCH ₃
	69	H	H	CH ₃	CH ₂ C=CH
	70	H	H	CH ₃	CH(CH ₃)C=CH
	71	H	H	CH ₃	CH ₂ C=CHCH ₃
30	72	H	H	CH ₃	Ph
	73	H	H	CH ₂ CH ₃	H
	74	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃
	75	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
	76	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
35	77	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
	78	H	H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂
	79	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	80	H	H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
	81	H	H	CH ₂ CH ₃	C(CH ₃) ₃
40	82	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₃
	83	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	84	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	85	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	86	H	H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
45	87	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ Cl
	88	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
	89	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃
	90	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃
	91	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN
	92	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
	93	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
	94	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ NH ₂
	95	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
	96	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₂ CH ₃) ₂
	97	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂

Nr.	R ⁴	R ⁵	R ⁷	R ⁸
98	H	H	CH ₂ CH ₃	C(CH ₃)=CH ₂
99	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃
100	H	H	CH ₂ CH ₃	C(CH ₃)CH=CHCH ₃
5 101	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH
102	H	H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C≡CH
103	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CHCH ₃
104	H	H	CH ₂ CH ₃	Ph
105	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
106	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
10 107	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
108	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
109	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
110	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂
111	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
15 112	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
113	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	C(CH ₃) ₃
114	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₃
115	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
116	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
117	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
20 118	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
119	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ Cl
120	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
121	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃
122	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃
25 123	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN
124	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
125	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
126	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ NH ₂
127	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
128	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₂ CH ₃) ₂
30 129	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
130	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	C(CH ₃)=CH ₂
131	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃
132	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	C(CH ₃)CH=CHCH ₃
133	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH
35 134	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C≡CH
135	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CHCH ₃
136	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Ph
137	H	H	CH(CH ₃) ₂	H
138	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
139	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
40 140	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
141	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
142	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂
143	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
144	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
45 145	H	H	CH(CH ₃) ₂	C(CH ₃) ₃
146	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ OCH ₃
147	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
148	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ OCH ₂ CH ₃

	Nr.	R ⁴	R ⁵	R ⁷	R ⁸
5	149	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	150	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
	151	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ Cl
	152	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
	153	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃
10	154	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃
	155	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CN
	156	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
	157	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
	158	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ NH ₂
15	159	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
	160	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ N(CH ₂ CH ₃) ₂
	161	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂
	162	H	H	CH(CH ₃) ₂	C(CH ₃)=CH ₂
	163	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CHCH ₃
20	164	H	H	CH(CH ₃) ₂	C(CH ₃)CH=CHCH ₃
	165	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ C=CH
	166	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃)C≡CH
	167	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ C=CHCH ₃
	168	H	H	CH(CH ₃) ₂	Ph
25	169	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	H
	170	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
	171	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
	172	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
	173	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
30	174	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ₂
	175	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	176	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
	177	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	C(CH ₃) ₃
	178	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ OCH ₃
35	179	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	180	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	181	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	182	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
	183	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ Cl
40	184	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
	185	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃
	186	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃
	187	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CN
	188	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
45	189	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
	190	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ NH ₂
	191	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
	192	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ N(CH ₂ CH ₃) ₂
	193	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
	194	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	C(CH ₃)=CH ₂
	195	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CHCH ₃
	196	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	C(CH ₃)CH=CHCH ₃
	197	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C≡CH
	198	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃)C≡CH
	199	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C≡CHCH ₃

Nr.	R ⁴	R ⁵	R ⁷	R ⁸
200	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	Ph
201	CH ₃	H	H	H
202	CH ₃	H	H	CH ₃
5 203	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₃
204	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃
205	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
206	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂
207	CH ₃	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
208	CH ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
10 209	CH ₃	H	H	C(CH ₃) ₃
210	CH ₃	H	H	CH ₂ OCH ₃
211	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
212	CH ₃	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
213	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
15 214	CH ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
215	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ Cl
216	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
217	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃
218	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃
219	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CN
20 220	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
221	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
222	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ NH ₂
223	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
224	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ N(CH ₂ CH ₃) ₂
25 225	CH ₃	H	H	CH ₂ CH=CH ₂
226	CH ₃	H	H	C(CH ₃)=CH ₂
227	CH ₃	H	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
228	CH ₃	H	H	C(CH ₃)CH=CHCH ₃
229	CH ₃	H	H	CH ₂ C≡CH
230	CH ₃	H	H	CH(CH ₃)C≡CH
30 231	CH ₃	H	H	CH ₂ C≡CHCH ₃
232	CH ₃	H	H	Ph
233	CH ₃	H		-(CH ₂) ₄ -
234	CH ₃	H		-(CH ₂) ₅ -
235	CH ₃	H		-(CH ₂) ₂ NH(CH ₂) ₂ -
35 236	CH ₃	H		-(CH ₂) ₂ NCH ₃ (CH ₂) ₂ -
237	CH ₃	H		-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -
238	CH ₃	H		-CH ₂ CH=CHCH ₂ -
239	CH ₃	H		-CH ₂ CH=CHCH ₂ CH ₂ -
240	CH ₃	H		-CH=CHCH ₂ CH ₂ CH ₂ -
40 241	CH ₃	H	CH ₃	H
242	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
243	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
244	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
245	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
246	CH ₃	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
45 247	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
248	CH ₃	H	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
249	CH ₃	H	CH ₃	C(CH ₃) ₃
250	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ OCH ₃

	Nr.	R ⁴	R ⁵	R ⁷	R ⁸
5	251	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	252	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	253	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	254	CH ₃	H	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
	255	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ Cl
10	256	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
	257	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃
	258	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃
	259	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN
	260	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
15	261	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
	262	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ NH ₂
	263	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
	264	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₂ CH ₃) ₂
	265	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
20	266	CH ₃	H	CH ₃	C(CH ₃)=CH ₂
	267	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃
	268	CH ₃	H	CH ₃	C(CH ₃)CH=CHCH ₃
	269	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH
	270	CH ₃	H	CH ₃	CH(CH ₃)C≡CH
25	271	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ C≡CHCH ₃
	272	CH ₃	H	CH ₃	Ph
	273	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	H
	274	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃
	275	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
30	276	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
	277	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
	278	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂
	279	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	280	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
35	281	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	C(CH ₃) ₃
	282	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₃
	283	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	284	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	285	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
40	286	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
	287	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ Cl
	288	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
	289	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃
	290	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃
45	291	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN
	292	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
	293	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
	294	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ NH ₂
	295	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
	296	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₂ CH ₃) ₂
	297	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
	298	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	C(CH ₃)=CH ₂
	299	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃
	300	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	C(CH ₃)CH=CHCH ₃
	301	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH

25

	Nr.	R ⁴	R ⁵	R ⁷	R ⁸
5	302	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C≡CH
	303	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CHCH ₃
	304	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	Ph
	305	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
	306	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
10	307	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
	308	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
	309	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
	310	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂
	311	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
15	312	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
	313	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	C(CH ₃) ₃
	314	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₃
	315	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	316	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
20	317	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	318	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
	319	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ Cl
	320	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
	321	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃
25	322	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃
	323	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN
	324	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
	325	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
	326	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ NH ₂
30	327	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
	328	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₂ CH ₃) ₂
	329	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
	330	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	C(CH ₃)=CH ₂
	331	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃
35	332	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	C(CH ₃)CH=CHCH ₃
	333	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH
	334	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C≡CH
	335	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CHCH ₃
	336	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Ph
40	337	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	H
	338	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
	339	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
	340	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
	341	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
45	342	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂
	343	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	344	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
	345	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	C(CH ₃) ₃
	346	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ OCH ₃
50	347	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	348	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	349	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	350	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
	351	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ Cl
	352	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃

	Nr.	R ⁴	R ⁵	R ⁷	R ⁸
5	353	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃
	354	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃
	355	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CN
	356	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
	357	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
10	358	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ NH ₂
	359	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
	360	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ N(CH ₂ CH ₃) ₂
	361	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂
	362	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	C(CH ₃)=CH ₂
15	363	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CHCH ₃
	364	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	C(CH ₃)CH=CHCH ₃
	365	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ C≡CH
	366	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃)C≡CH
	367	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ C≡CHCH ₃
20	368	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Ph
	369	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	H
	370	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
	371	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
	372	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
25	373	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
	374	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ₂
	375	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	376	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
	377	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	C(CH ₃) ₃
30	378	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ OCH ₃
	379	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	380	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	381	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	382	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
35	383	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ Cl
	384	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
	385	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃
	386	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃
	387	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CN
40	388	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
	389	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
	390	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ NH ₂
	391	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
	392	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ N(CH ₂ CH ₃) ₂
45	393	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
	394	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	C(CH ₃)=CH ₂
	395	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CHCH ₃
	396	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	C(CH ₃)CH=CHCH ₃
	397	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C≡CH
	398	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃)C≡CH
	399	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C≡CHCH ₃
	400	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	Ph
	401	CH ₃	CH ₃	H	H
	402	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃
	403	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃

	Nr.	R ⁴	R ⁵	R ⁷	R ⁸
5	404	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃
	405	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
	406	CH ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
	407	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	408	CH ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
10	409	CH ₃	CH ₃	H	C(CH ₃) ₃
	410	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCH ₃
	411	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	412	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	413	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
15	414	CH ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
	415	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ Cl
	416	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
	417	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃
	418	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃
20	419	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CN
	420	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
	421	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
	422	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ NH ₂
	423	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
25	424	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ N(CH ₂ CH ₃) ₂
	425	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂
	426	CH ₃	CH ₃	H	C(CH ₃)=CH ₂
	427	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
	428	CH ₃	CH ₃	H	C(CH ₃)CH=CHCH ₃
30	429	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ C≡CH
	430	CH ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)C≡CH
	431	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ C≡CHCH ₃
	432	CH ₃	CH ₃	H	Ph
	433	CH ₃	CH ₃		-(CH ₂) ₄ -
35	434	CH ₃	CH ₃		-(CH ₂) ₅ -
	435	CH ₃	CH ₃		-(CH ₂) ₂ NH(CH ₂) ₂ -
	436	CH ₃	CH ₃		-(CH ₂) ₂ NCH ₃ (CH ₂) ₂ -
	437	CH ₃	CH ₃		-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -
	438	CH ₃	CH ₃		-CH ₂ CH=CHCH ₂ -
40	439	CH ₃	CH ₃		-CH ₂ CH=CHCH ₂ CH ₂ -
	440	CH ₃	CH ₃		-CH=CHCH ₂ CH ₂ CH ₂ -
	441	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H
	442	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	443	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃
45	444	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
	445	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
	446	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
	447	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	448	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
	449	CH ₃	CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₃
	450	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃
	451	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	452	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	453	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	454	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃

	Nr.	R ⁴	R ⁵	R ⁷	R ⁸
5	455	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ Cl
	456	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
	457	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃
	458	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃
	459	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN
10	460	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
	461	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
	462	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ NH ₂
	463	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
	464	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₂ CH ₃) ₂
15	465	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
	466	CH ₃	CH ₃	CH ₃	C(CH ₃)=CH ₂
	467	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃
	468	CH ₃	CH ₃	CH ₃	C(CH ₃)CH=CHCH ₃
	469	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ C≡CH
20	470	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃)C≡CH
	471	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ C≡CHCH ₃
	472	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Ph
	473	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H
	474	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃
25	475	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
	476	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
	477	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
	478	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂
	479	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
30	480	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
	481	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	C(CH ₃) ₃
	482	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₃
	483	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	484	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
35	485	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	486	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
	487	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ Cl
	488	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
	489	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃
40	490	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃
	491	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN
	492	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
	493	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
	494	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ NH ₂
45	495	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
	496	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₂ CH ₃) ₂
	497	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
	498	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	C(CH ₃)=CH ₂
	499	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃
50	500	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	C(CH ₃)CH=CHCH ₃
	501	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH
	502	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C≡CH
	503	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CHCH ₃
	504	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	Ph
	505	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H

	Nr.	R ⁴	R ⁵	R ⁷	R ⁸
5	506	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
	507	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
	508	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
	509	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
	510	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂
10	511	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	512	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
	513	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	C(CH ₃) ₃
	514	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₃
	515	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
15	516	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	517	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	518	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
	519	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ Cl
	520	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
20	521	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃
	522	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃
	523	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN
	524	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
	525	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
25	526	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ NH ₂
	527	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
	528	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₂ CH ₃) ₂
	529	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
	530	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	C(CH ₃)=CH ₂
30	531	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃
	532	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	C(CH ₃)CH=CHCH ₃
	533	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ C=CH
	534	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C=CH
	535	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ C=CHCH ₃
35	536	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Ph
	537	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H
	538	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
	539	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
	540	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
40	541	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
	542	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂
	543	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	544	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
	545	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	C(CH ₃) ₃
45	546	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ OCH ₃
	547	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	548	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	549	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
	550	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
55	551	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ Cl
	552	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
	553	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃
	554	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃
	555	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CN
	556	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃

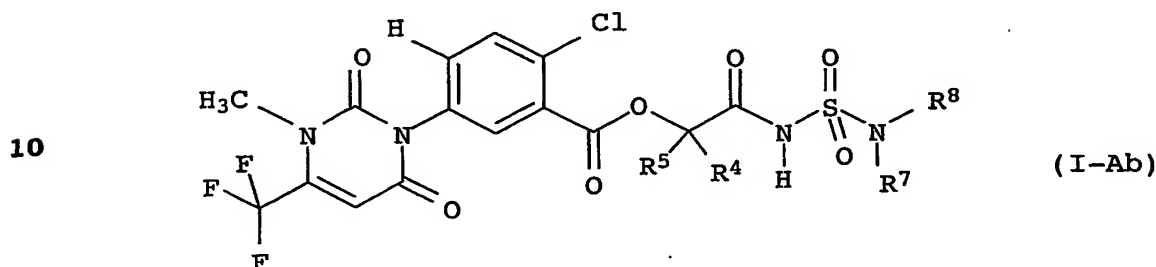
Nr.	R ⁴	R ⁵	R ⁷	R ⁸
557	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
558	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ NH ₂
559	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
560	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ N(CH ₂ CH ₃) ₂
561	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂
562	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	C(CH ₃)=CH ₂
563	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CHCH ₃
564	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	C(CH ₃)CH=CHCH ₃
565	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ C=CH
566	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃)C≡CH
567	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ C≡CHCH ₃
568	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	Ph
569	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H
570	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
571	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
572	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
573	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
574	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ₂
575	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
576	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
577	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	C(CH ₃) ₃
578	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ OCH ₃
579	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
580	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
581	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
582	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
583	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ Cl
584	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
585	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃
586	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃
587	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CN
588	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
589	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
590	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ NH ₂
591	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
592	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ N(CH ₂ CH ₃) ₂
593	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
594	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	C(CH ₃)=CH ₂
595	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CHCH ₃
596	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	C(CH ₃)CH=CHCH ₃
597	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C≡CH
598	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃)C≡CH
599	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C≡CHCH ₃
600	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	Ph

Ganz besonders bevorzugt sind auch die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoesäure-Derivate der Formel I-Ab (\equiv I mit R¹ = II-A, R¹⁰ = Methyl, R¹¹ = Trifluormethyl und R¹² = Wasserstoff, R² = H; R³ = Cl; R⁶ = H, X = O), worin R⁴, R⁵, R⁷ und R⁸ die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen,

31

gen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Ab.1 bis I-Ab.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

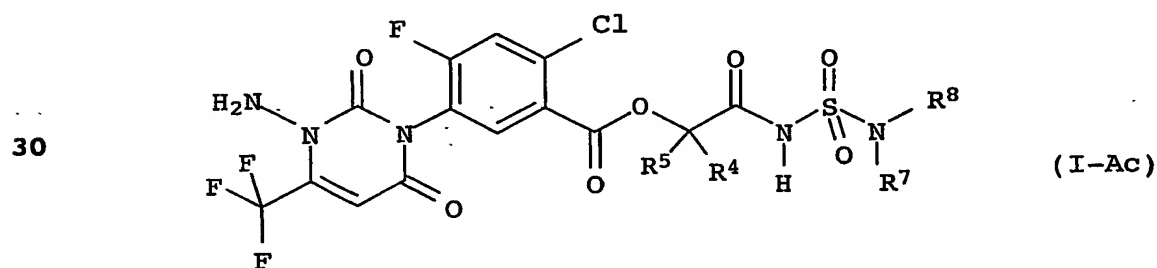


15

Ganz besonders bevorzugt sind auch die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Ac (\equiv I mit $R^1 = \text{II-A}$, $R^{10} = \text{Amino}$, $R^{11} = \text{Trifluormethyl}$ und $R^{12} = \text{Wasserstoff}$; $R^2 = \text{F}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$), worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten

20 Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Ac.1 bis I-Ac.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

25



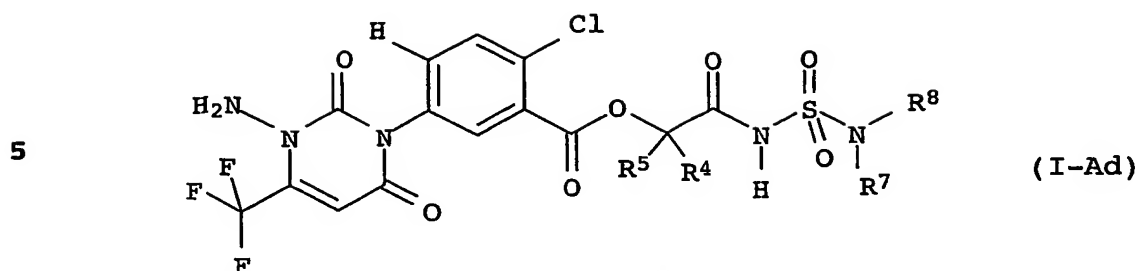
35

Ganz besonders bevorzugt sind auch die 3-Heterocyclcyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Ad (\equiv I mit $R^1 = \text{II-A}$, $R^{10} = \text{Amino}$, $R^{11} = \text{Trifluormethyl}$ und $R^{12} = \text{Wasserstoff}$; $R^2 = \text{H}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$), worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten

40 Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Ad.1 bis I-Ad.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

45

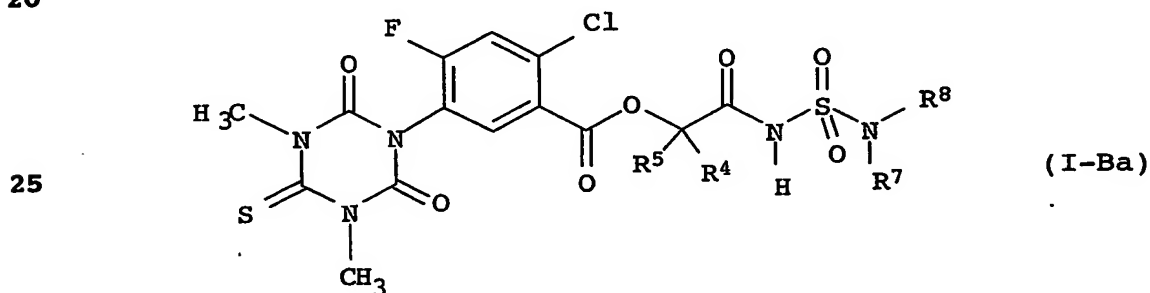
32



10

Unter den Verbindungen I-B sind die 3-Heterocyclcyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Ba (\equiv I mit $R^1 = \text{II-B}$, $R^{13'}$, R^{13} jeweils Methyl; $R^2 = \text{F}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt angegebenen Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Ba.1 bis I-Ba.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20



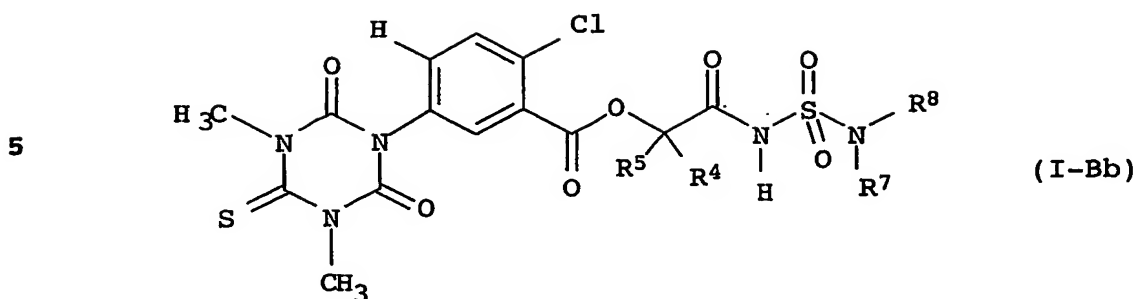
30 Unter den Verbindungen I-B sind die 3-Heterocycllyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Bb (\equiv I mit $R^1 = \text{II-B}$, $R^{13'}$, R^{13} jeweils Methyl; $R^2 = \text{H}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für

35 derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Bb.1 bis I-Bb.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

40

45

33

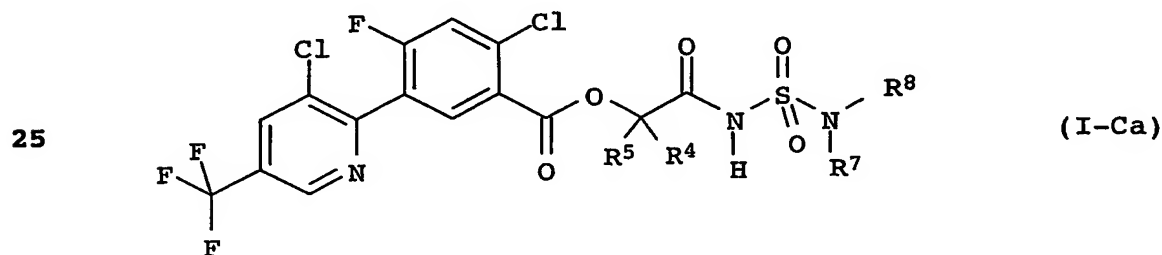


10

Unter den Verbindungen I-C sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Ca (\equiv I mit $R^1 = \text{II-C}$, $R^{14} = \text{Chlor}$, R^{15} , $R^{17} = \text{Wasserstoff}$, $R^{16} = \text{Trifluormethyl}$; $R^2 = \text{F}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben ge-

15 nannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Ca.1 bis I-Ca.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20



30

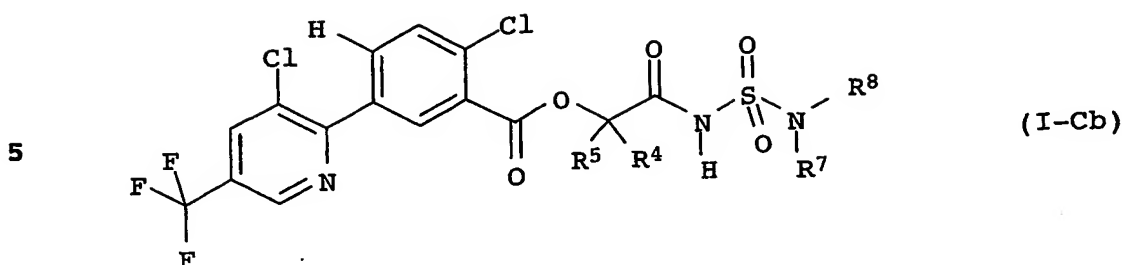
Unter den Verbindungen I-C sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Cb (\equiv I mit $R^1 = \text{II-C}$, $R^{14} = \text{Chlor}$, R^{15} , $R^{17} = \text{Wasserstoff}$, $R^{16} = \text{Trifluormethyl}$; $R^2 = \text{H}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben ge-

35 nannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Cb.1 bis I-Cb.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebe-

40 nen Bedeutungen aufweisen.

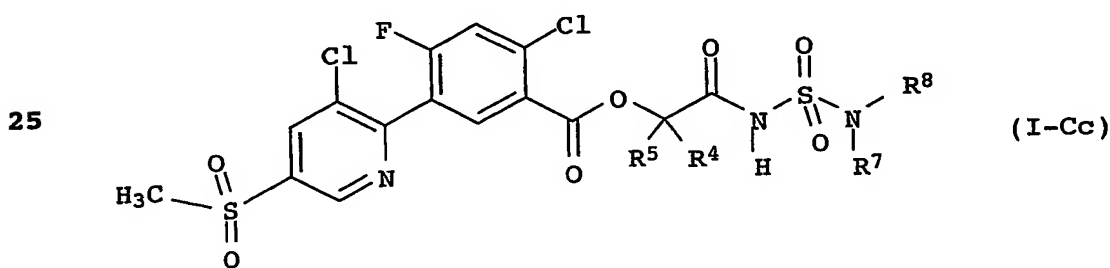
45

34



10

Unter den Verbindungen I-C sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Cc (\equiv I mit $R^1 = \text{II-C}$, $R^{14} = \text{Chlor}$, R^{15} , $R^{17} = \text{Wasserstoff}$, $R^{16} = \text{Methylsulfonyl}$; $R^2 = \text{F}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Cc.1 bis I-Cc.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

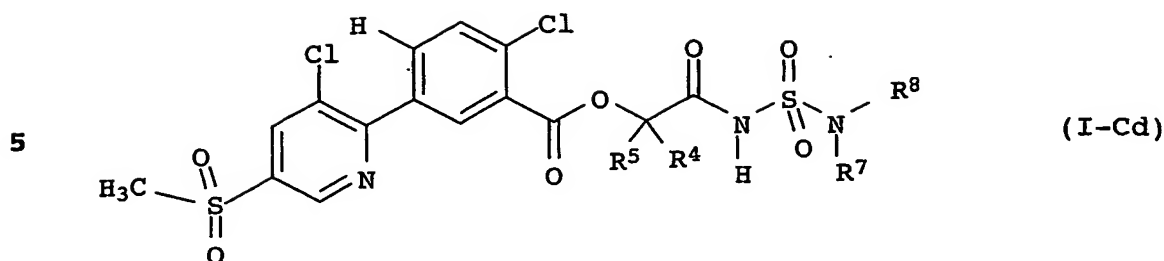


30

Unter den Verbindungen I-C sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Cd (\equiv I mit $R^1 = \text{II-C}$, $R^{14} = \text{Chlor}$, R^{15} , $R^{17} = \text{Wasserstoff}$, $R^{16} = \text{Methylsulfonyl}$; $R^2 = \text{H}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Cd.1 bis I-Cd.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

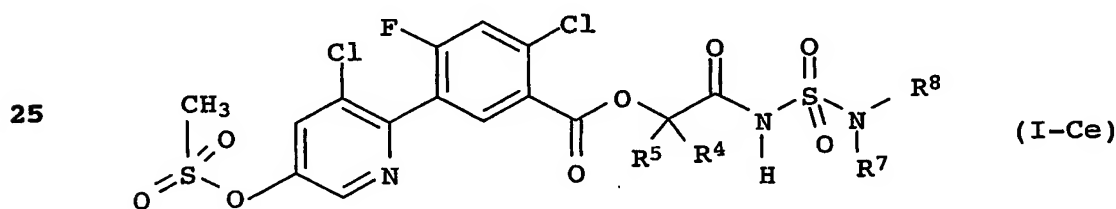
45

35



10

Unter den Verbindungen I-C sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Ce (\equiv I mit $R^1 = \text{II-C}$, $R^{14} = \text{Chlor}$, R^{15} , $R^{17} = \text{Wasserstoff}$, $R^{16} = \text{Methylsulfonyloxy}$; $R^2 = \text{F}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Ce.1 bis I-Ce.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

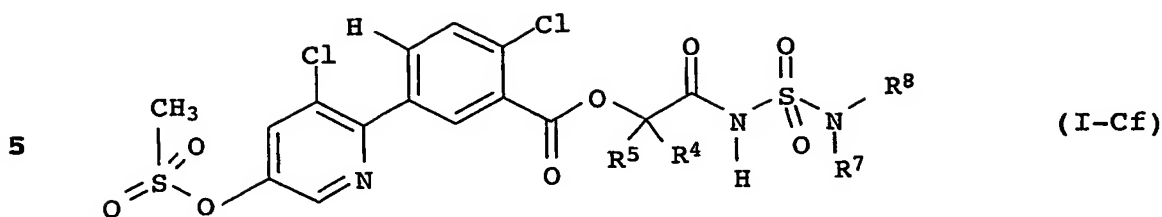


30

Unter den Verbindungen I-C sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Cf (\equiv I mit $R^1 = \text{II-C}$, $R^{14} = \text{Chlor}$, R^{15} , $R^{17} = \text{Wasserstoff}$, $R^{16} = \text{Methylsulfonyloxy}$; $R^2 = \text{H}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Cf.1 bis I-Cf.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

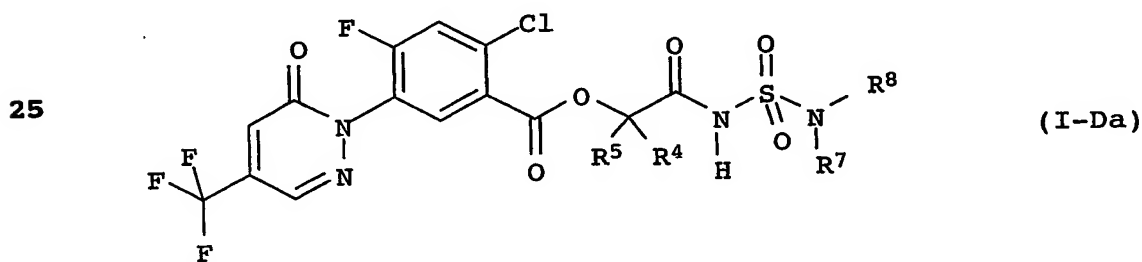
45

36



10

Unter den Verbindungen I-D sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Da (\equiv I mit $R^1 = \text{II-D}$, R^{18} , $R^{20} = \text{Wasserstoff}$, $R^{19} = \text{Trifluormethyl}$; $R^2 = \text{F}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X =$
 15 0) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Da.1 bis I-Da.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8
 20 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

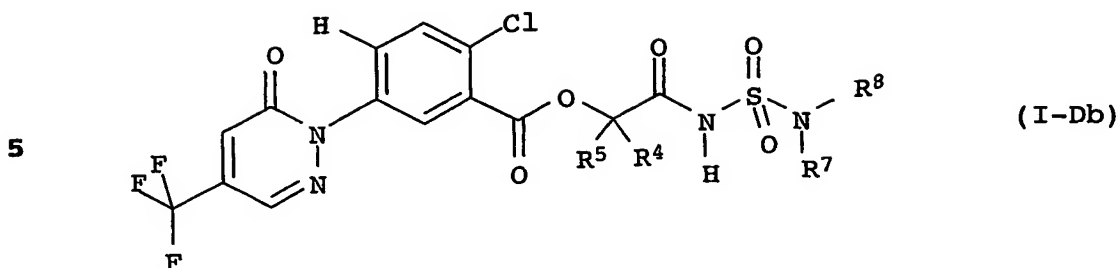


30

Unter den Verbindungen I-D sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Db (\equiv I mit $R^1 = \text{II-D}$, R^{18} , $R^{20} = \text{Wasserstoff}$, $R^{19} = \text{Trifluormethyl}$; $R^2 = \text{H}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X =$
 35 0) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Db.1 bis I-Db.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8
 40 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

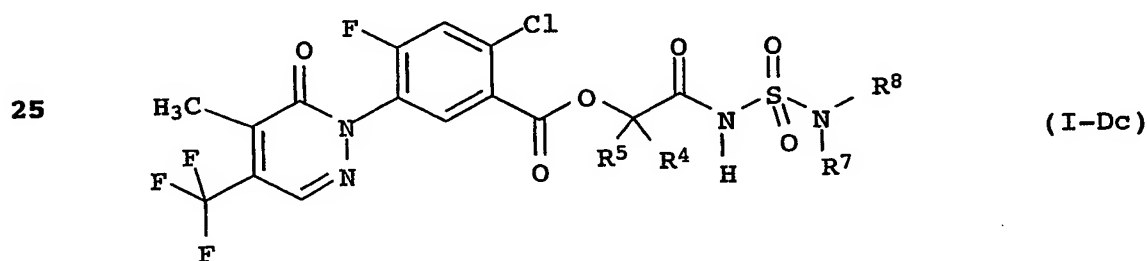
45

37



10

Unter den Verbindungen I-D sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Dc (\equiv I mit $R^1 = \text{II-D}$, $R^{18} = \text{Methyl}$, $R^{19} = \text{Trifluormethyl}$, $R^{20} = \text{Wasserstoff}$; $R^2 = \text{F}$; $R^3 = \text{Cl}$;
 15 $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Dc.1 bis I-Dc.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen
 20 Bedeutungen aufweisen.

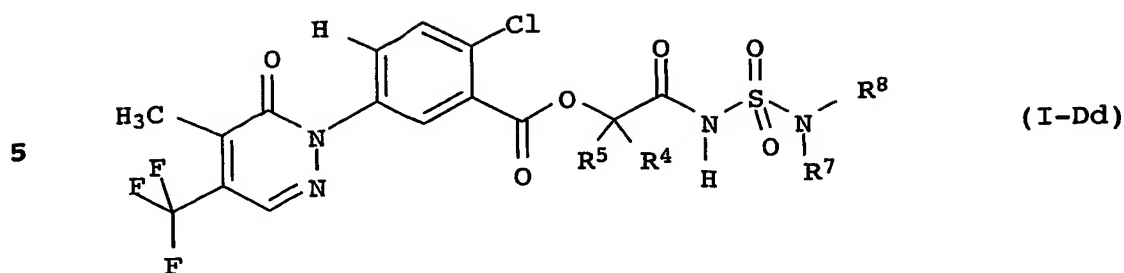


30

Unter den Verbindungen I-D sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Dd (\equiv I mit $R^1 = \text{II-D}$, $R^{18} = \text{Methyl}$, $R^{19} = \text{Trifluormethyl}$, $R^{20} = \text{Wasserstoff}$; $R^2 = \text{H}$; $R^3 = \text{Cl}$;
 35 $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Dd.1 bis I-Dd.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 ,
 40 R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

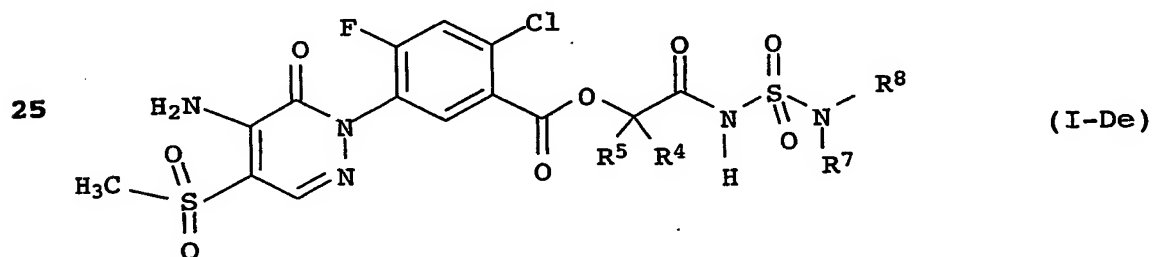
45

38



10

Unter den Verbindungen I-D sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-De (\equiv I mit $R^1 = \text{II-D}$, $R^{18} = \text{Amino}$, $R^{19} = \text{Methylsulfonyl}$, $R^{20} = \text{Wasserstoff}$; $R^2 = \text{F}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-De.1 bis I-De.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

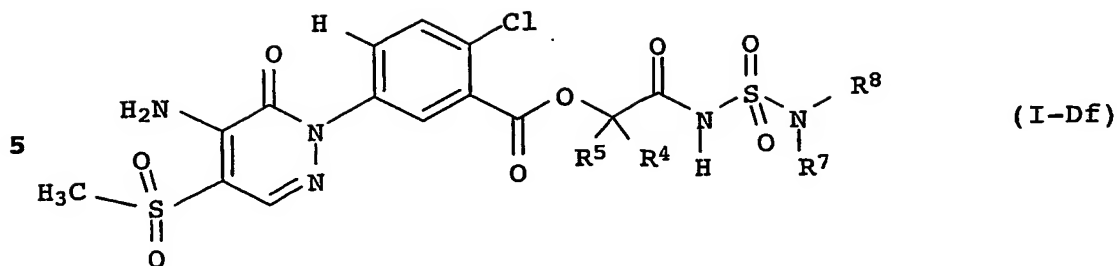


30

Unter den Verbindungen I-D sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Df (\equiv I mit $R^1 = \text{II-D}$, $R^{18} = \text{Amino}$, $R^{19} = \text{Methylsulfonyl}$, $R^{20} = \text{Wasserstoff}$; $R^2 = \text{H}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Df.1 bis I-Df.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

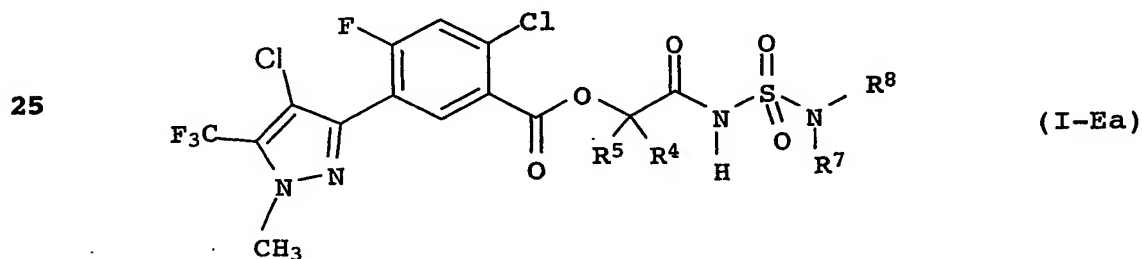
45

39



10

Unter den Verbindungen I-E sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Ea (\equiv I mit $R^1 = \text{II-E}$, $R^{21} = \text{Chlor}$, $R^{22} = \text{Trifluormethyl}$, $R^{23} = \text{Methyl}$; $R^2 = \text{F}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Ea.1 bis I-Ea.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

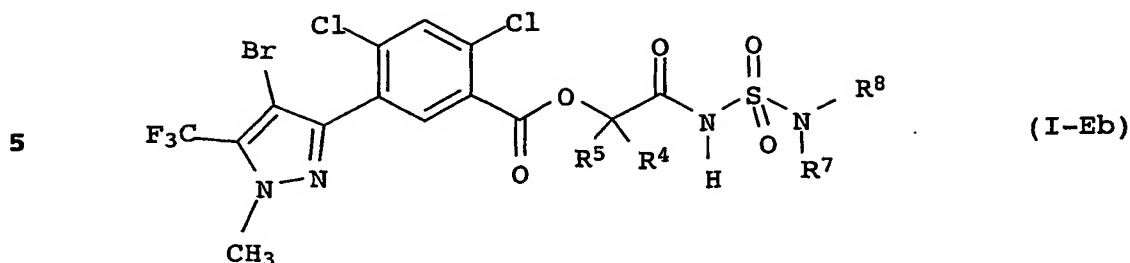


30

Unter den Verbindungen I-E sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Eb (\equiv I mit $R^1 = \text{II-E}$, $R^{21} = \text{Brom}$, $R^{22} = \text{Trifluormethyl}$, $R^{23} = \text{Methyl}$; $R^2 = \text{Cl}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Eb.1 bis I-Eb.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

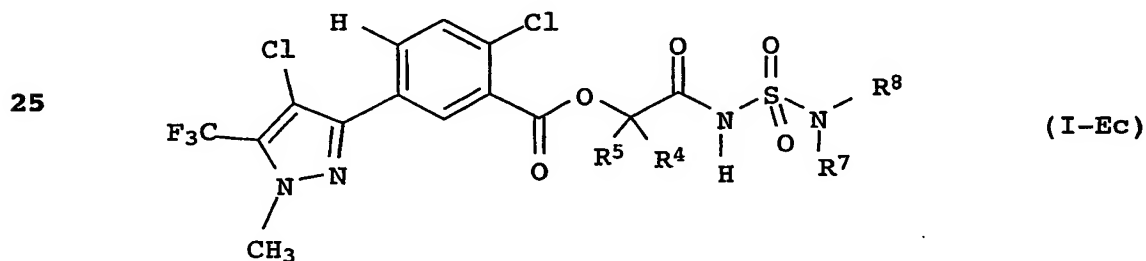
45

40



10

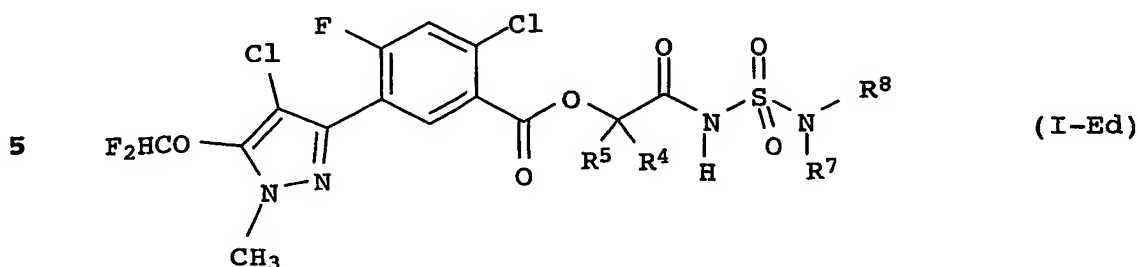
Unter den Verbindungen I-E sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Ec (\equiv I mit $R^1 = \text{II-E}$, $R^{21} = \text{Chlor}$, $R^{22} = \text{Trifluormethyl}$, $R^{23} = \text{Methyl}$; $R^2 = \text{H}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$,
 15 $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Ec.1 bis I-Ec.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und
 20 R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.



Unter den Verbindungen I-E sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Ed (\equiv I mit $R^1 = \text{II-E}$, $R^{21} = \text{Chlor}$, $R^{22} = \text{Difluormethoxy}$, $R^{23} = \text{Methyl}$; $R^2 = \text{F}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$,
 35 $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Ed.1 bis I-Ed.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und
 40 R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

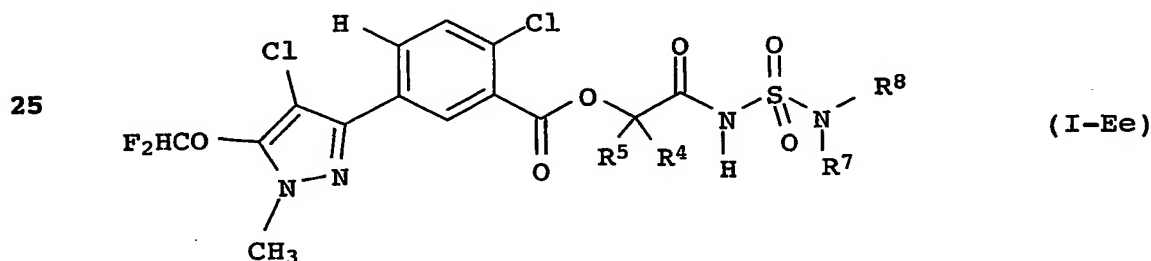
45

41



10

Unter den Verbindungen I-E sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Ee (\equiv I mit $R^1 = \text{II-E}$, $R^{21} = \text{Chlor}$, $R^{22} = \text{Difluormethoxy}$, $R^{23} = \text{Methyl}$; $R^2 = \text{H}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$,
 15 $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Ee.1 bis I-Ee.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeu-
 20 tungen aufweisen.

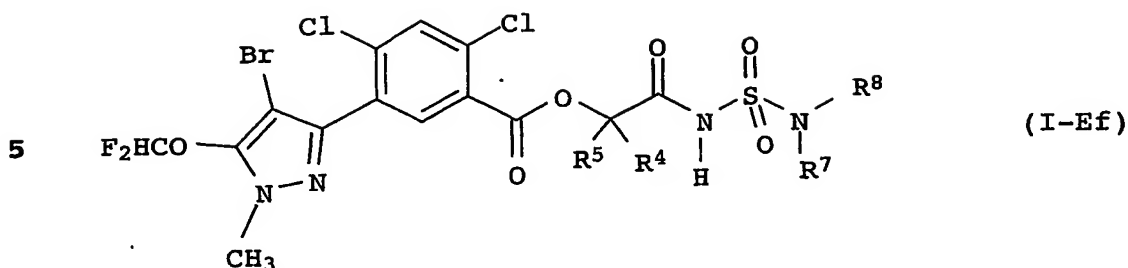


30

Unter den Verbindungen I-E sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Ef (\equiv I mit $R^1 = \text{II-E}$, $R^{21} = \text{Brom}$, $R^{22} = \text{Difluormethoxy}$, $R^{23} = \text{Methyl}$; $R^2 = \text{Cl}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$,
 35 $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Ef.1 bis I-Ef.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und
 40 R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

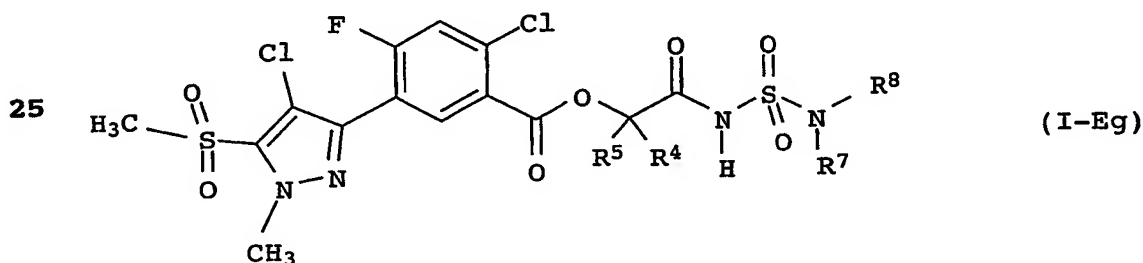
45

42



10

Unter den Verbindungen I-E sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Eg (\equiv I mit $R^1 = \text{II-E}$, $R^{21} = \text{Chlor}$, $R^{22} = \text{Methylsulfonyl}$, $R^{23} = \text{Methyl}$; $R^2 = \text{F}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Eg.1 bis I-Eg.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

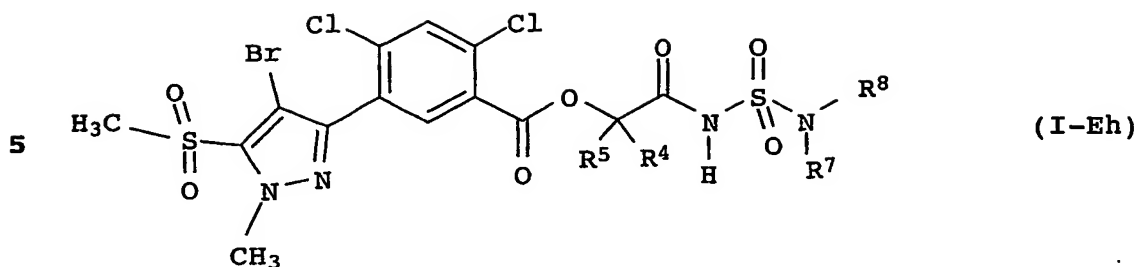


30

Unter den Verbindungen I-E sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Eh (\equiv I mit $R^1 = \text{II-E}$, $R^{21} = \text{Brom}$, $R^{22} = \text{Methylsulfonyl}$, $R^{23} = \text{Methyl}$; $R^2 = \text{Cl}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Eh.1 bis I-Eh.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

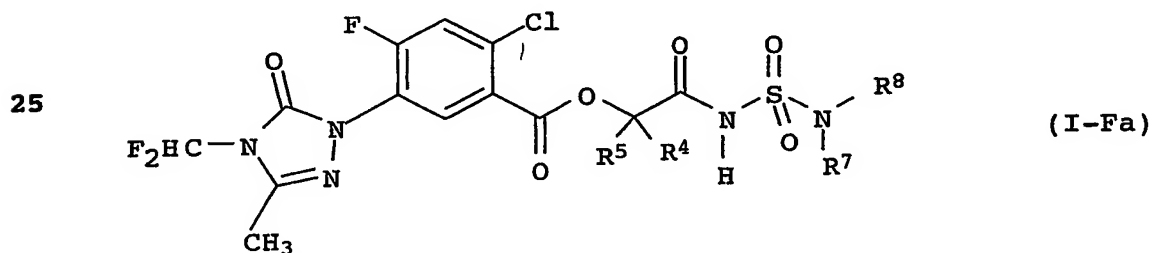
45

43



10

Unter den Verbindungen I-F sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Fa (\equiv I mit $R^1 = \text{II-F}$, $R^{24} = \text{Difluormethyl}$, $R^{25} = \text{Methyl}$; $R^2 = \text{F}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Fa.1 bis I-Fa.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

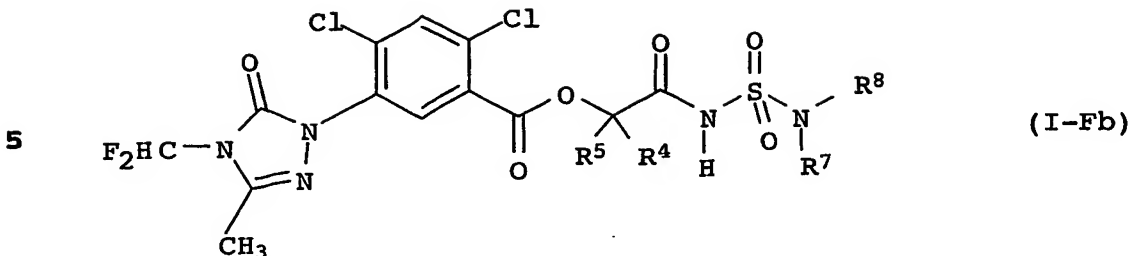


30

Unter den Verbindungen I-F sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Fb (\equiv I mit $R^1 = \text{II-E}$, $R^{24} = \text{Difluormethyl}$, $R^{25} = \text{Methyl}$; $R^2 = \text{Cl}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Fb.1 bis I-Fb.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

45

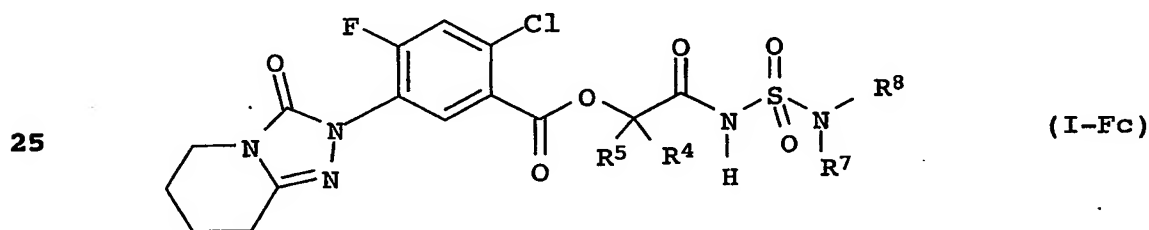
44



10

Unter den Verbindungen I-F sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Fc (\equiv I mit $R^1 = \text{II-F}$, R^{24} , $R^{25} = (\text{CH}_2)_4$; $R^2 = \text{F}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Fc.1 bis I-Fc.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20



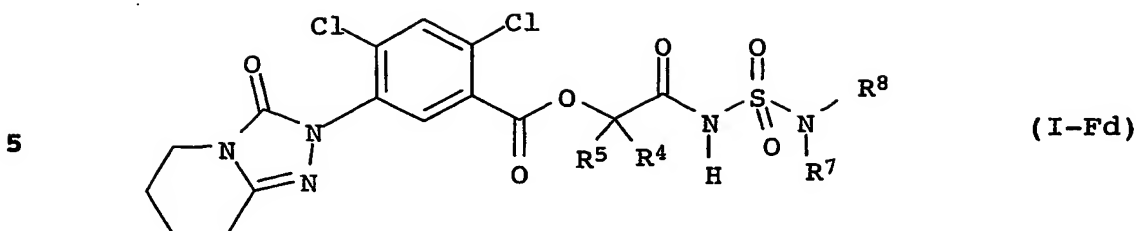
30

Unter den Verbindungen I-F sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Fd (\equiv I mit $R^1 = \text{II-F}$, R^{24} , $R^{25} = (\text{CH}_2)_4$; $R^2 = \text{Cl}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Fd.1 bis I-Fd.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

40

45

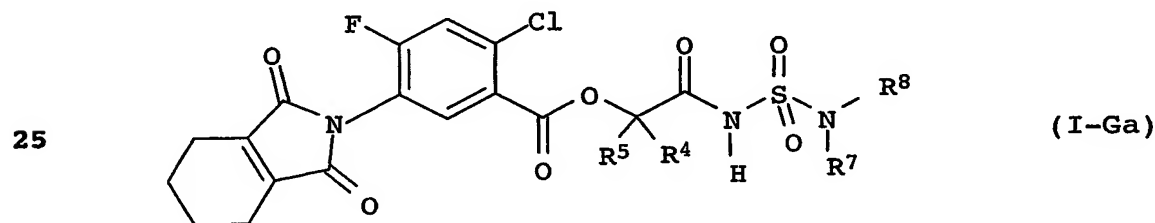
45



10

Unter den Verbindungen I-G sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Ga (\equiv I mit R¹ = II-G, A¹, A² jeweils Sauerstoff; R² = F; R³ = Cl; R⁶ = H, X = O) bevorzugt, wo-
15 rin R⁴, R⁵, R⁷ und R⁸ die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Ga.1 bis I-Ga.600, in denen die Variablen R⁴, R⁵, R⁷ und R⁸ gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20



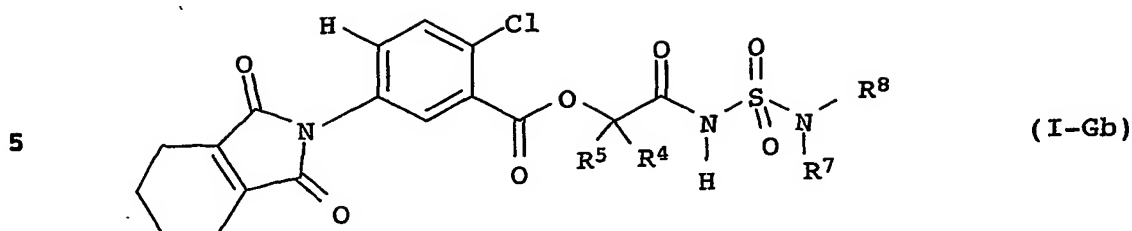
30

Unter den Verbindungen I-G sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Gb (\equiv I mit R¹ = II-G, A¹, A² jeweils Sauerstoff; R² = H; R³ = Cl; R⁶ = H, X = O) bevorzugt, wo-
35 rin R⁴, R⁵, R⁷ und R⁸ die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Gb.1 bis I-Gb.600, in denen die Variablen R⁴, R⁵, R⁷ und R⁸ gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

40

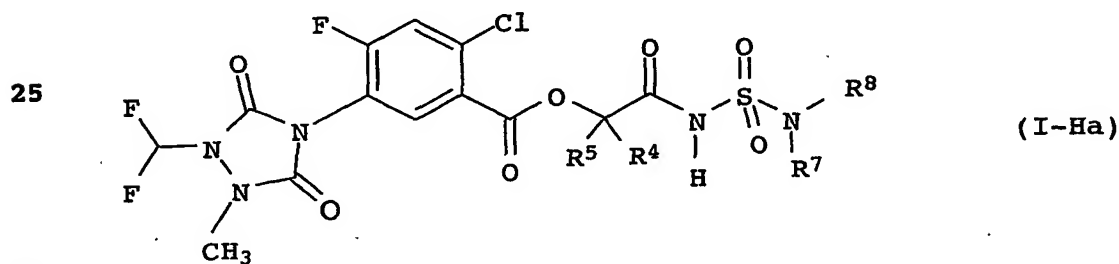
45

46



10

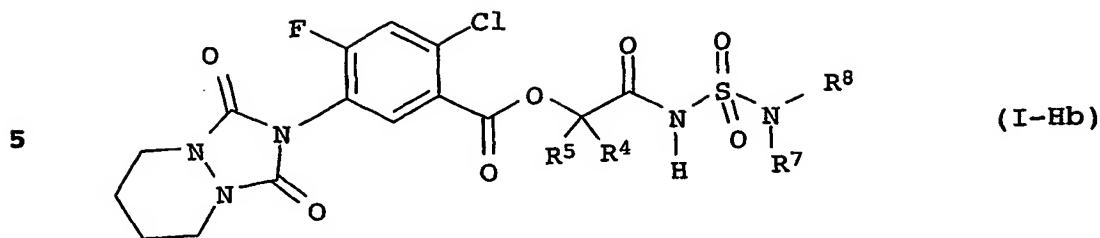
Unter den Verbindungen I-H sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Ha (\equiv I mit $R^1 = \text{II-H}$, A^3 und A^4 jeweils Sauerstoff, $R^{26} = \text{Difluormethyl}$, $R^{27} = \text{Methyl}$; $R^2 = \text{F}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Ha.1 bis I-Ha.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.



Unter den Verbindungen I-H sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Hb (\equiv I mit $R^1 = \text{II-H}$, A^3 und A^4 jeweils Sauerstoff, R^{26} und R^{27} zusammen für Tetramethylen; $R^2 = \text{F}$; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Hb.1 bis I-Hb.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

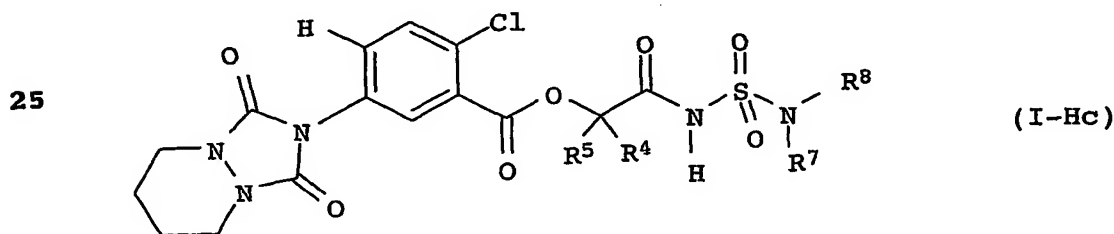
45

47



10

Unter den Verbindungen I-H sind die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate der Formel I-Hc (\equiv I mit $R^1 = \text{II-H}$, A^3 und A^4 jeweils Sauerstoff, R^{26} und R^{27} zusammen für Tetramethylen; $R^2 =$ 15 H; $R^3 = \text{Cl}$; $R^6 = \text{H}$, $X = \text{O}$) bevorzugt, worin R^4 , R^5 , R^7 und R^8 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen I-Hc.1 bis I-Hc.600, in denen die Variablen R^4 , R^5 , R^7 und R^8 gemeinsam die in einer Zeile der Ta- 20 belle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.



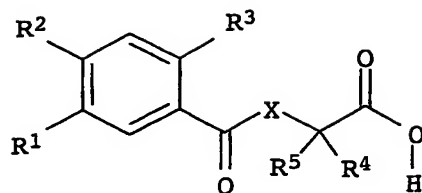
30

Die erfindungsgemäßen 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate können in Anlehnung an bekannte Verfahren hergestellt 35 werden. Sofern keine gezielte Synthese zur Isolierung reiner Isomere durchgeführt wird, kann das Produkt als Isomerengemisch anfallen. Die Mischungen können gewünschtenfalls nach den hierfür üblichen Methoden wie Kristallisation oder Chromatographie, auch an einem optisch aktiven Adsorbat, in die weitgehend reinen Iso- 40 meren getrennt werden. Reine optisch aktive Isomere lassen sich beispielsweise auch aus den entsprechenden optisch aktiven Ausgangsmaterialien herstellen.

In der Regel stellt man die 3-Heterocyclyl substituierten Verbindungen der Formel I durch Umsetzung eines 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivat der allgemeinen Formel III,

48

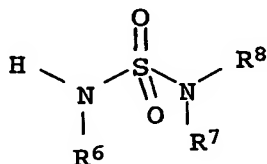
5



(III)

10 worin R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 und X die zuvor genannten Bedeutungen aufweisen, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kupplungsmittels, oder das entsprechende Säurehalogenid zu III mit einem Sulfamid der Formel IV,

15



(IV)

20

worin R^6 , R^7 und R^8 die zuvor genannten Bedeutungen aufweisen, her. Verfahren zur Aktivierung von Carbonsäuren sind beispielsweise aus Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, Bd. E5

25 (1985), Teil 1, SS. 587 ff und Bd. E5 (1985), Teil II, SS. 934 ff bekannt. Die Umsetzung aktivierter Carbonsäuren III bzw. Carbonsäurehalogeniden von III kann in Analogie zu der in WO 01/83459 beschriebenen Herstellung von Carboxylsulfamiden erfolgen, z. B. nach der auf S. 31 f beschriebenen Weise.

30

Vorzugsweise aktiviert man zunächst die Carbonsäure III, indem man sie mit einem Kupplungsmittel umsetzt. Anschließend setzt man die aktivierte Carbonsäure III in der Regel ohne vorherige Isolierung mit dem Sulfamid IV um. Als Kupplungsmittel kommen beispielsweise N,N' -Carbonyldiimidazol oder Carbodiimide wie Dicyclohexylcarbodiimid in Betracht. Diese werden in der Regel wenigstens in äquimolarer Menge und bis zu einem vierfachen Überschuss, bezogen auf die Carbonsäure III, eingesetzt. Gegebenenfalls erwärmt man das erhaltene Reaktionsgemisch aus Carbonsäure

40 III und Kupplungsmittel und lässt dann auf Raumtemperatur abkühlen. Üblicherweise führt man die Umsetzung in einem Lösungsmittel durch. Als Lösungsmittel kommen z. B. chlorierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, Ether z. B. Dialkylether wie Diethylether, Methyl-tert.-butylether oder cyclische

45 Ether wie Tetrahydrofuran oder Dioxan, Carbonsäureamide wie Dimethylformamid, N-Methylactame wie N-Methylpyrrolidon, Nitrile wie Acetonitril, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, aromati-

sche Amine wie Pyridin oder Gemische hiervon in Betracht. Anschließend versetzt man mit dem Sulfamid IV. In der Regel löst man das Sulfamid IV in dem Lösungsmittel, das auch zur Aktivierung der Carbonsäure verwendet wurde.

5

- Alternativ kann man auch die Carbonsäure III zunächst mit einem anorganischen Säurehalogenid, vorzugsweise einem Säurechlorid wie Thionylchlorid, Phosphorylchlorid, Phosphorpentachlorid, Oxalylchlorid oder Phosphortrichlorid in das entsprechende Säurehalogenid zu III überführen, gegebenenfalls das gebildete Säurehalogenid isolieren, und anschließend mit dem Sulfamid IV umsetzen. Gegebenenfalls steigert man die Reaktivität des Thionylchlorids durch Zusatz katalytischer Mengen Dimethylformamid. Üblicherweise setzt man das Halogenierungsmittel wenigstens in äquimolarer Menge, bezogen auf die Carbonsäure, ein. Der Reaktionspartner Thionylchlorid, Phosphortrichlorid oder Phosphorylchlorid kann gleichzeitig als Lösungsmittel fungieren. Geeignete Lösungsmittel sind ferner unter den Reaktionsbedingungen inerte Lösungsmittel beispielsweise chlorierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Benzol oder Toluol, aliphatische und cycloaliphatische Kohlenwasserstoffe wie Hexan, Petrolether, Cyclohexan und deren Gemische. Die Reaktionstemperatur liegt in der Regel zwischen Raumtemperatur und dem Siedepunkt des Lösungsmittels. Nach beendeter Umsetzung entfernt man in der Regel den Überschuss an Halogenierungsmittel. Anschließend versetzt man das so erhaltene Säurechlorid von III mit dem Sulfamid IV. In der Regel löst man das Sulfamid IV in dem Lösungsmittel, das auch zur Herstellung des Carbonsäurehalogenids verwendet wurde, sofern es sich bei dem Lösungsmittel nicht um eines der vorgenannten Säurehalogenide handelt.

35

- Selbstverständlich können auch andere Verfahren zur Aktivierung der Carbonsäure verwendet werden. Solche Verfahren sind im Stand der Technik beschrieben.
- Das molare Verhältnis von Carbonsäure III bzw. aktivierter Carbonsäure zu III bzw. des entsprechenden Säurechlorids zu III zu Sulfamid IV beträgt in der Regel wenigstens 0,9:1, vorzugsweise wenigstens 1:1. Gegebenenfalls kann es auch vorteilhaft sein, das Sulfamid IV in einem geringen Überschuss, beispielsweise in einem bis zu 30%igem Überschuss, bezogen auf die Carbonsäure III, einzusetzen.

- Üblicherweise führt man die Umsetzung in Gegenwart einer Base, die vorzugsweise in äquimolarer Menge oder bis zu einem vierfachen Überschuss, bezogen auf Carbonsäure III, eingesetzt wird, durch. Geeignete Basen sind beispielsweise Amine wie 1,5-Dizabi-

cyclo[4.3.0]non-5-en (DBN), 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU), Pyridin oder Triethylamin. Gegebenenfalls kann es von Vorteil sein, die Umsetzung in Gegenwart einer katalytischen Menge 4-Dimethylaminopyridin (DMAP) durchzuführen. Der Zusatz an Base beträgt in der Regel 5 bis 10 mol-%, bezogen auf aktivierte Carbonsäure III.

In der Regel liegt die Reaktionstemperatur im Bereich von 0 °C bis zur Höhe des Siedepunktes des Reaktionsgemisches. Die Aufarbeitung kann in an sich bekannter Weise erfolgen.

Die Verbindungen der Formel IV sind nach an sich bekannten Verfahren erhältlich, zum Beispiel nach von G. Hamprecht in Angew. Chem. 93, 151 - 163 (1981) beschriebenen Verfahren oder nach den Verfahren, wie sie in WO 01/83459, DE 102 21 910.9 oder in Houben-Weyl, Bd. E11 (1985), S. 1019 beschrieben werden.

3-Heterocyclyl substituierte Benzoessäure-Derivate der allgemeinen Formel III sind im Stand der Technik bekannt oder lassen sich in Anlehnung an bekannte Verfahren, häufig ausgehend von den entsprechenden Estern zu III, herstellen.

Die Ester werden dann nach bekannten Verfahren durch Hydrolyse im sauren Milieu unter Verwendung von starken Mineralsäuren wie konzentrierte Salzsäure oder Schwefelsäure oder organischen Säuren wie Eisessig oder Gemischen davon in die entsprechenden Carbonsäuren III überführt. Alternativ lassen sich Ester auch im alkalischen Milieu unter Verwendung von Basen wie Alkalihydroxid, beispielsweise Natriumhydroxid oder Kaliumhydroxid in Gegenwart von Wasser hydrolysieren.

Als Lösungsmittel sowohl für die säure- als auch für die basenkatalysierte Hydrolyse von Estern kommen beispielsweise auch chlorierte aliphatische oder alicyclische Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid oder 1,2-Dichlorethan oder Alkohole in Betracht. Bei der säurekatalysierten Hydrolyse ist üblicherweise der Reaktionspartner gleichzeitig auch das Lösungsmittel und wird daher im Überschuss, bezogen auf den Ester eingesetzt. Die Reaktionstemperatur liegt üblicherweise zwischen Raumtemperatur und dem Siedepunkt des Lösungsmittels.

Ester der Carbonsäure III, worin R¹ für einen heterocyclischen Rest der Formel II-A steht, sind beispielsweise aus US 6,207,830 und DE 197 41 411 bekannt. Ester von Carbonsäuren der Formel III, worin R¹ für einen heterocyclischen Rest der Formel II-C steht, sind aus WO 97/11059 bekannt. Ester von Carbonsäuren der Formel III, worin R¹ für einen Rest II-E steht, sind beispielsweise aus

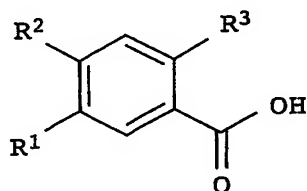
51

WO 92/06962 und JP 09059113 bekannt. Ester von Carbonsäuren der Formel II-F sind z. B. aus JP 61069776 bekannt. Verbindungen III, die in diesen Schriften nicht explizit beschrieben sind, lassen sich in Anlehnung an diese Verfahren herstellen.

5

Soweit die Ester von Carbonsäuren der Formel III nicht bekannt sind, kann man sie beispielsweise durch Umsetzung einer 3-Heterocyclyl substituierten Benzoesäure der Formel V,

10



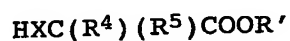
15

(V)

20

worin R¹, R² und R³ die zuvor genannten Bedeutungen aufweisen, mit einem α -Aminocarbonsäureester oder einem α -Hydroxycarbonsäureester der Formel VI,

25



(VI)

worin X, R⁴ und R⁵ die zuvor genannten Bedeutungen aufweisen und R' für Niederalkyl steht, in Gegenwart eines wasserentziehenden Mittels wie N,N'-Carbonyldiimidazol oder Dicyclohexylcarbodiimid herstellen. Alternativ kann man auch die Benzoesäure der Formel V zunächst in ihr Säurehalogenid überführen und anschließend mit der Verbindung der Formel VI umsetzen.

30

Die Reaktionsbedingungen entsprechen im Wesentlichen den zuvor für die Umsetzung von III mit IV genannten Bedingungen. Üblicherweise führt man die Umsetzung in einem Lösungsmittel durch. Geeignete Lösungsmittel sind chlorierte Kohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, Ether, wie Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Tetrahydrofuran, Dioxan oder Gemische

40 hiervon. Die Umsetzung mit einer Verbindung der Formel VI erfolgt üblicherweise bei einer Temperatur zwischen Raumtemperatur und dem Siedepunkt des Lösungsmittels. Abschließend hydrolysiert man den erhaltenen Ester von III, wobei man die gewünschte 3-Heterocyclyl substituierte Carbonsäure III erhält. Bezüglich der Durchführung der Hydrolyse sei auf das zuvor Gesagte verwiesen.

45

Die Carbonsäure V lässt sich beispielsweise nach WO 01/083459 oder dem darin zitierten Stand der Technik oder in Anlehnung an die darin beschriebenen Verfahren herstellen. Gegebenenfalls muss der im Stand der Technik beschriebene Ester nach bekannten Verfahren in die Carbonsäure V überführt werden. Bezüglich der säure- oder basenkatalysierten Hydrolyse von Estern sei auf das zuvor Gesagte verwiesen. Ausdrücklich verwiesen sei auf folgende Schriften:

- 10 WO 88/10254, WO 89/02891, WO 89/03825, WO 91/00278 (Verbindungen der Formel V beziehungsweise deren Ester, worin R^1 für einen heterocyclischen Rest der Formel II-A steht), EP 0 584 655, WO 00/050409 (die Ester der Verbindungen der Formel V, worin R^1 für einen heterocyclischen Rest der Formel II-B steht), WO 96/39392,
- 15 WO 97/07104 (Verbindungen der Formel V und/oder der entsprechenden Ester zu V, worin R^1 für einen heterocyclischen Rest der Formel II-D steht), WO 92/06962 (Verbindungen der Formel V, worin R^1 für einen heterocyclischen Rest der Formel II-E).
- 20 Die Verbindungen I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze eignen sich - sowohl als Isomerengemische als auch in Form der reinen Isomeren - als Herbizide. Die I enthaltenden herbiziden Mittel bekämpfen Pflanzenwuchs auf Nichtkulturflächen sehr gut. In Kulturen wie Weizen, Reis, Mais, Soja und Baumwolle wirken sie
- 25 gegen Unkräuter und Schadgräser, ohne die Kulturpflanzen nennenswert zu schädigen. Dieser Effekt tritt vor allem bei niedrigen Aufwandmengen auf.

In Abhängigkeit von der jeweiligen Applikationsmethode können

- 30 die Verbindungen I bzw. sie enthaltenden herbiziden Mittel noch in einer weiteren Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden. In Betracht kommen beispielsweise folgende Kulturen:

- 35 *Allium cepa*, *Ananas comosus*, *Arachis hypogaea*, *Asparagus officinalis*, *Beta vulgaris* spec. altissima, *Beta vulgaris* spec. rapa, *Brassica napus* var. napus, *Brassica napus* var. napobrassica, *Brassica rapa* var. silvestris, *Camellia sinensis*, *Carthamus tinctorius*, *Carya illinoensis*, *Citrus limon*, *Citrus*
- 40 *sinensis*, *Coffea arabica* (*Coffea canephora*, *Coffea liberica*), *Cucumis sativus*, *Cynodon dactylon*, *Daucus carota*, *Elaeis guineensis*, *Fragaria vesca*, *Glycine max*, *Gossypium hirsutum*, (*Gossypium arboreum*, *Gossypium herbaceum*, *Gossypium vitifolium*), *Helianthus annuus*, *Hevea brasiliensis*, *Hordeum vulgare*, *Humulus*
- 45 *lupulus*, *Ipomoea batatas*, *Juglans regia*, *Lens culinaris*, *Linum usitatissimum*, *Lycopersicon lycopersicum*, *Malus* spec., *Manihot esculenta*, *Medicago sativa*, *Musa* spec., *Nicotiana tabacum*

(*N.rustica*), *Olea europaea*, *Oryza sativa*, *Phaseolus lunatus*, *Phaseolus vulgaris*, *Picea abies*, *Pinus spec.*, *Pisum sativum*, *Prunus avium*, *Prunus persica*, *Pyrus communis*, *Ribes sylvestre*, *Ricinus communis*, *Saccharum officinarum*, *Secale cereale*, *Solanum*
5 *tuberosum*, *Sorghum bicolor* (s. *vulgare*), *Theobroma cacao*, *Tri-
folium pratense*, *Triticum aestivum*, *Triticum durum*, *Vicia faba*,
Vitis vinifera und *Zea mays*.

Darüber hinaus können die Verbindungen I auch in Kulturen, die
10 durch Züchtung einschließlich gentechnischer Methoden gegen die
Wirkung von Herbiziden tolerant sind, verwandt werden.

Des Weiteren eignen sich die Verbindungen I und deren landwirt-
schaftlich brauchbaren Salze auch zur Desikkation und/oder
15 Defoliation von Pflanzen.

Als Desikkantien eignen sie sich insbesondere zur Austrocknung
der oberirdischen Teile von Kulturpflanzen wie Kartoffel, Raps,
Sonnenblume und Sojabohnen. Damit wird ein vollständig mechani-
20 sches Beernten dieser wichtigen Kulturpflanzen ermöglicht.

Von wirtschaftlichem Interesse ist auch
- das zeitlich konzentrierte Abfallen von Früchten oder das
Vermindern ihrer Haftfestigkeit an der Pflanze, beispiels-
25 weise bei Zitrusfrüchten, Oliven oder anderen Arten und Sor-
ten von Kern-, Stein- und Schalenobst, da hierdurch die Ernte
dieser Früchte erleichtert wird, sowie
- das kontrollierte Entblättern von Nutzpflanzen, insbesondere
Baumwolle (Defoliation).

30 Das durch die Anwendung von erfindungsgemäßen Wirkstoffen der
Formel I geförderte Abfallen beruht auf der Ausbildung von Trenn-
gewebe zwischen Frucht- oder Blatt- und Sproßteil der Pflanzen.

35 Die Baumwolldefoliation ist von ganz besonderem wirtschaftlichem
Interesse, da sie die Ernte erleichtert. Gleichzeitig führt die
Verkürzung des Zeitintervalls, in dem die einzelnen Pflanzen reif
werden, zu einer erhöhten Qualität des geernteten Fasermaterials.

40 Die Verbindungen I bzw. die sie enthaltenden herbiziden Mittel
können beispielsweise in Form von direkt versprühbaren wässrigen
Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wässrigen,
öligen oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen,
Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln oder Granu-
45 laten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen, Gießen
oder Behandlung des Saatgutes bzw. Mischen mit dem Saatgut ange-
wendet werden. Die Anwendungsformen richten sich nach den Verwen-

dungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Die herbiziden Mittel enthalten eine herbizid wirksame Menge mindestens eines Wirkstoffes der Formel I und für die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsstoffe.

Als inerte Hilfsstoffe kommen im Wesentlichen in Betracht: Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt wie Kerosin und Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Paraffine, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline und deren Derivate, alkylierte Benzole und deren Derivate, Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol und Cyclohexanol, Ketone wie Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, z.B. Amine wie N-Methylpyrrolidon und Wasser.

Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Suspensionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitete werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivate I als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. Lignin-, Phenol-, Naphthalin- und Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanolen sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner Derivate mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenyl-, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylen- oder Polyoxypropylenalkylether, Laurylalkoholpolyglykoletheracetat, Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

- 5 Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löss, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und
- 10 Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.

- 15 Die Konzentrationen der Wirkstoffe I in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in weiten Bereichen variiert werden. Die Formulierungen enthalten im allgemeinen etwa 0,001 bis 98 Gew.-%, vorzugsweise 0,01 bis 95 Gew.-%, mindestens eines Wirkstoffs I.
- 20 Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90 % bis 100 %, vorzugsweise 95 % bis 100 % (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen I können beispielsweise wie folgt formuliert werden:

- 25 I. 20 Gewichtsteile einer Verbindung I werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen alkyliertem Benzol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanol-
- 30 amid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die
- 35 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- II. 20 Gewichtsteile einer Verbindung I werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlage-
- 40 rungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die
- 45 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

56

- III. 20 Gewichtsteile einer Verbindung I werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 65 Gewichtsteilen einer Mineralölfraction vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 5
- IV. 20 Gewichtsteile einer Verbindung I werden mit 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin- α -sulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20 000 Gewichtsteilen Wasser enthält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 10
- 15
- V. 3 Gewichtsteile einer Verbindung I werden mit 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 20
- VI. 20 Gewichtsteile einer Verbindung I werden mit 2 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gewichtsteilen Fettalkoholpolyglykoether, 2 Gewichtsteilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölige Dispersion.
- 25
- 30
- VII. 1 Gewichtsteil einer Verbindung I wird in einer Mischung gelöst, die aus 70 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 20 Gewichtsteilen ethoxyliertem Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen ethoxyliertem Rizinusöl besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.
- 35
- VIII. 1 Gewichtsteil einer Verbindung I wird in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Cyclohexanon und 20 Gewichtsteilen Wettol® EM 31 (= nichtionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Rizinusöl; BASF AG) besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.
- 40

Die Applikation der Wirkstoffe I bzw. der herbiziden Mittel kann im Vorauf- oder im Nachaufverfahren erfolgen. Es besteht auch die Möglichkeit, die herbiziden Mittel bzw. Wirkstoffe dadurch zu applizieren, dass mit den herbiziden Mitteln bzw. Wirkstoffen vorbehandeltes Saatgut einer Kulturpflanze ausgebracht

45

wird. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, dass die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen 5 nach Möglichkeit nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).

Die Aufwandmengen an Wirkstoff I betragen je nach Bekämpfungs-
10 ziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0,001 bis 3,0, vorzugsweise 0,01 bis 1,0 kg/ha aktive Substanz (a.S.).

Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die 3-Heterocyclyl substituierte Benzoesäure-Derivate I mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider
15 oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt und gemeinsam ausgebracht werden.

Beispielsweise kommen als Mischungspartner 1,2,4-Thiadiazole,
20 1,3,4-Thiadiazole, Amide, Aminophosphorsäure und deren Derivate, Aminotriazole, Anilide, Aryloxy-/Heteroaryloxyalkansäuren und deren Derivate, Benzoessäure und deren Derivate, Benzothiadinone, 2-(Heteroaryl/Aroyl)-1,3-cyclohexandione, Heteroaryl-Arylketone, Benzylisoxazolidinone, meta-CF₃-Phenylderivate, Carbamate,
25 Chinolincarbonsäure und deren Derivate, Chloracetanilide, Cyclohexan-1,3-dionderivate, Diazine, Dichlorpropionsäure und deren Derivate, Dihydrobenzofurane, Dihydrofuran-3-one, Dinitroaniline, Dinitrophenole, Diphenylether, Dipyridyle, Halogencarbonsäuren und deren Derivate, Harnstoffe, 3-Phenyluracile, Imidazole,
30 Imidazolinone, N-Phenyl-3,4,5,6-tetrahydrophthalimide, Oxadiazole, Oxirane, Phenole, Aryloxy- und Heteroaryloxyphenoxypropionsäureester, Phenylelessigsäure und deren Derivate, 2-Phenylpropionsäure und deren Derivate, Pyrazole, Phenylpyrazole, Pyridazine, Pyridincarbonsäure und deren Derivate, Pyrimidyl-
35 ether, Sulfonamide, Sulfonylharnstoffe, Triazine, Triazinone, Triazolinone, Triazolcarboxamide und Uracile in Betracht.

Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen I allein oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren
40 Pflanzenschutzmitteln gemischt, gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können
45 auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

Die folgenden Beispiele sollen die Erfindung erläutern, ohne sie einzuschränken.

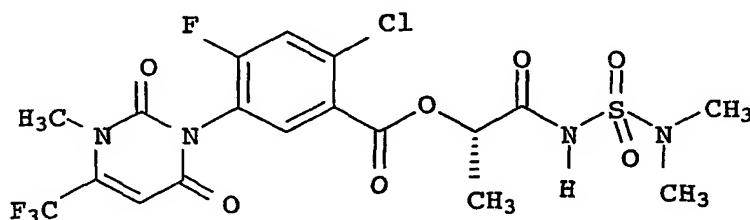
Herstellungsbeispiele

5

Beispiel 1: (S)-2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluorbenzoyloxy]-propionsäure-N,N-dimethylsulfamid (S-Enantiomer von Verbindung I-Aa. 242)

10

15



I-Aa.242

20 1.1: 2-Chlor-4-fluor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)benzoesäure

Man löste 13,9 g (34 mmol) 2-Chlor-4-fluor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimi-

25 din-1-yl)benzoesäureisopropylester (CAS-Nr. 105756-82-9, US

5,176,735, US 4,943,309, WO 88/10254) in 100 ml Eisessig und 100 ml konz. HCl und erhitze 15 Stunden auf 70 °C. Man entfernte die Essigsäure im Vakuum, nahm den Rückstand in Wasser auf und saugte den ausgefallenen Niederschlag. Nach dem Trocknen erhielt man

30 11,3 g der Uracilcarbonsäure, die ohne weitere Reinigung im nächsten Schritt eingesetzt wurde.

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ (ppm) = 8,1 (d, 1 H), 7,8 (d, 1 H), 6,6 (s, 1 H), 3,4 (s, 3 H).

35

1.2: (S)-2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluorbenzoyl]-propionsäuremethylester

40 Man erhitze 5,0 g (13,64 mmol) Uracilcarbonsäure aus 1.1 in 50 ml Thionylchlorid 3 h zum Rückfluss und entfernte anschließend nicht umgesetztes Thionylchlorid im Vakuum. Danach löste man das erhaltene Säurechlorid in 50 ml Methylenchlorid und tropfte unter Rühren die erhaltene Lösung bei 0-5 °C zu einer Lösung von 1,6 g
45 (15,01 mmol) (S)-Milchsäuremethylester, 0,2 g (1,36 mmol) 4-Dimethylaminopyridin (DMAP) und 1,7 g (16,37 mmol) Triethylamin in 80 ml CH_2Cl_2 . Man ließ auf Raumtemperatur erwärmen und rührte 16

59

Stunden bei Raumtemperatur nach. Anschließend engte man das Reaktionsgemisch ein und chromatographierte an Kieselgel mit Cyclohexan/Essigester 70/30. Man verdampfte das Lösungsmittel unter vermindertem Druck und erhielt 5,85 g des Esters.

5

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ (ppm) = 8,0 (d, 1 H), 7,4 (d, 1 H), 6,4 (s, 1 H), 5,4 (q, 1 H), 4,8 (s, 3 H), 3,6 (s, 3 H), 1,5 (d, 3 H).

1.3: (S)-2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluorbenzoyl]-propionsäure
10

Man versetzte 3,6 g (8 mmol) Ester aus 1.2 mit 25 ml Eisessig und 25 ml konz. HCl, erwärmte 4 Stunden auf 60 °C und rührte 8 Stunden bei Raumtemperatur nach. Man entfernte die Essigsäure im Vakuum, verdünnte das Reaktionsgemisch mit Wasser und extrahierte dreimal mit je etwa 150 ml Essigsäureethylester. Anschließend trocknete man die vereinigten organischen Phasen über Na_2SO_4 und engte im Vakuum ein, wobei man 3,3 g Säure erhielt.

20 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ (ppm) = 8,0 (d, 1 H), 7,4 (d, 1 H), 6,4 (s, 1 H), 5,4 (q, 1 H), 3,5 (s, 3 H), 1,6 (d, 3 H).

1.4: (S)-2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluorbenzoyloxy]-propionsäure-N,N-dimethylsulfamid
25

Man erhitzte 0,45 g (1,03 mmol) Säure aus 1.3 in 10 ml Thionylchlorid 3 Stunden zum Rückfluss, entfernte anschließend überschüssiges Thionylchlorid im Vakuum und löste das erhaltene Säurechlorid in etwa 5 ml CH_2Cl_2 . Diese Lösung wurde bei etwa 5 °C zu einer Lösung von 0,13 g (1,03 mmol) N,N-Dimethylsulfamid, 0,23 g (2,23 mmol) Triethylamin und einer katalytischen Menge DMAP in 20 ml CH_2Cl_2 getropft. Man rührte 14 Stunden bei Raumtemperatur, engte das Reaktionsgemisch im Vakuum ein. Man nahm den Rückstand
35 in Essigsäureethylester auf und wusch mit etwa 200 ml 10%-iger Salzsäure. Die Chromatographie an Kieselgel mit Cyclohexan/Essigester 70/30 ergab 0,16 g der Titelverbindung mit Schmp. 207-208 °C.

40 $^1\text{H-NMR}$: siehe Tabelle 2

Beispiel 2: 2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)benzoyloxy]-2-methylpropionsäure-N-methyl-N-allylsulfamid (Verbindung I-Ab.465)

45

Man löste 0,33 g (2,2 mmol) N-Methyl-N-allylsulfamid, 0,27 g 4-Dimethylaminopyridin und 0,64 ml Triethylamin in 10 ml Dichlormethan. Danach tropfte man eine Lösung von 0,98 g (2,2 mmol) 2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)benzoyloxy]-2-methylpropionsäurechlorid (CAS-Nr. 160152-72-7) in Dichlormethan zu. Man rührte die Lösung 3 Tage, engte ein und nahm den Rückstand in Ethylacetat auf. Die organische Phase wusch man mit 10 %iger Salzsäure und Wasser, trocknete über Natriumsulfat, filtrierte das Trockenmittel ab und engte ein. Die Säulenchromatographie an Kieselgel (Eluens: Cyclohexan/Ethylacetat 2:1) ergab 0,21 g der Titelverbindung mit einem Schmelzpunkt von 161-164 °C.

Beispiel 3: (S)-2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)benzoyloxy]propionsäure-N-methyl-N-allylsulfamid (S-Enantiomer von Verbindung I-Ab.265)

3.1: (S)-2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)benzoyloxy]propionsäuremethylester

Man löste 7,0 g (20 mmol) 2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)benzoesäure (CAS-Nr. 120890-58-6) in 50 ml Thionylchlorid. Danach erhitze man das Reaktionsgemisch 3 Stunden am Rückfluss und engte die so erhaltene Lösung des Säurechlorids ein. Anschließend löste man 2,3 g (22 mmol) (S)-Milchsäuremethylester, 2,46 g (20 mmol) 4-Dimethylaminopyridin und 2,44 g (20 mmol) Triethylamin in 50 ml Dichlormethan und tropfte bei 0 °C eine Lösung des zuvor erhaltenen Säurechlorids in Dichlormethan zu. Das Reaktionsgemisch rührte man 16 Stunden bei Raumtemperatur und engte danach die Lösung ein. Die Säulenchromatographie an Kieselgel (Eluens: Cyclohexan/Ethylacetat 2:1) ergab 7,0 g (S)-2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)benzoyloxy]propionsäuremethylester mit einem Schmelzpunkt von 59-60 °C.

3.2: (S)-2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)benzoyloxy]propionsäure

Man löste 7,0 g (16 mmol) (S)-2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)benzoyloxy]propionsäuremethylester aus Beispiel 3.1 in 50 ml Essigsäure, versetzte mit 50 ml konz. Salzsäure und erhitze die Lösung 4 Stunden am Rückfluss. Die Essigsäure destillierte man weitgehend ab und goss die verbleibende Lösung auf Eiswasser. Die wässrige Phase extrahierte man dreimal mit Ethyl-

acetat, trocknete die organische Phase über Natriumsulfat, filtrierte das Trockenmittel ab und engte bis zur Trockne ein, wobei man 5,7 g (S)-2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)benzoyloxy]propionsäure erhielt. 5 hielt.

3.3: (S)-2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)benzoyloxy]propionsäurechlorid

- 10 Man löste 5,7 g (14 mmol) (S)-2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)benzoyloxy]propionsäure aus Beispiel 3.2 in 50 ml Thionylchlorid und erhitzte das Reaktionsgemisch 3,5 Stunden am Rückfluss. Man ließ abkühlen und engte die Lösung ein, wobei man 5,9 g (S)-2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)benzoyloxy]propionsäurechlorid erhielt. 15

3.4: (S)-2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)benzoyloxy]propionsäure-N-methyl-N-allylsulfamid 20

- Man löste 0,33 g (2,2 mmol) N-Methyl-N-allylsulfamid, 0,27 g 4-Dimethylaminopyridin und 0,67 ml Triethylamin in 10 ml Dichlormethan und tropfte eine Lösung von 0,98 g (2,2 mmol) (S)-2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)benzoyloxy]propionsäurechlorid aus Beispiel 3.3 in 10 ml Dichlormethan zu. Die Lösung rührte man 16 Stunden, engte danach ein und löste den erhaltenen Rückstand in Ethylacetat. Die organische Phase wusch man mit 10%iger Salzsäure und 30 Wasser, trocknete die organische Phase über Natriumsulfat, filtrierte vom Trockenmittel ab und engte ein. Die Säulenchromatographie an Kieselgel ergab 0,26 g der Titelverbindung.

Beispiel 4: 2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluorbenzoyloxy]-2-methylpropionsäure-N-methyl-N-allylsulfamid (Verbindung I-Aa.442) 35

4.1: 2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluorbenzoyloxy]-2-methylpropionsäuremethylester 40

- Man löste 0,61 g (5,2 mmol) 2-Hydroxy-2-methylpropionsäuremethylester, 70 mg (0,5 mmol) 4-N-Pyrrolidinopyridin und 0,87 ml (6,2 mmol) Triethylamin in 50 ml Tetrahydrofuran und tropfte danach eine Lösung von 2 g (5,2 mmol) des Säurechlorids aus Beispiel 1.2 45 in 50 ml Tetrahydrofuran zu. Man rührte die Lösung 16 Stunden, engte ein und löste danach den Rückstand in Ethylacetat. Die or-

ganische Phase wusch man mit 10%iger Zitronensäure und Wasser, trocknete die organische Phase über Natriumsulfat, filtrierte das Trockenmittel ab und engte ein. Die Säulenchromatographie an Kieselgel (Eluens: Cyclohexan/Ethylacetat 2:1) ergab 1,0 g

- 5 2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluorbenzoyloxy]-2-methylpropionsäuremethylester.

- 4.2: 2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluorbenzoyloxy]-2-methylpropionsäure
10

- Man löste 1,0 g (2,1 mmol) 2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluorbenzoyloxy]-2-methylpropionsäuremethylester aus
15 Beispiel 4.1 in 50 ml Essigsäure, gab 50 ml konz. Salzsäure zu und erhitze das Reaktionsgemisch 5 Stunden am Rückfluss. Die Essigsäure destillierte man weitgehend ab und goss die verbleibende Lösung in Eiswasser. Man filtrierte den ausgefallenen Niederschlag ab und trocknete, wobei man 0,65 g 2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluorbenzoyloxy]-2-methylpropionsäure erhielt.
20

- 4.3: 2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluorbenzoyloxy]-2-methylpropionsäure
25 N,N-dimethylsulfamid

- Man löste 0,65 g (1,4 mmol) 2-[2-Chlor-5-(3-methyl-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluorbenzoyloxy]-2-methylpropionsäure aus Beispiel
30 4.2 in 30 ml Thionylchlorid, erhitze das Reaktionsgemisch 3 Stunden am Rückfluss und engte danach die erhaltene Lösung des Säurechlorids ein. 0,18 g (1,4 mmol) N,N-Dimethylsulfamid, 0,07 g (1,4 mmol) 4-Dimethylaminopyridin und 0,35 ml (3,5 mmol) Triethylamin löste man in 10 ml Dichlormethan und tropfte danach
35 eine Lösung des zuvor hergestellten Säurechlorids in 10 ml Dichlormethan zu. Man rührte die Lösung 16 Stunden, engte anschließend ein und löste danach den Rückstand in Ethylacetat. Die organische Phase wusch man mit 10%iger Salzsäure und Wasser, trocknete die organische Phase über Natriumsulfat, filtrierte das
40 Trockenmittel ab und engte ein. Die Säulenchromatographie an Kieselgel (Eluens: Cyclohexan/Ethylacetat 2:1) ergab 0,30 g der Titelverbindung mit einem Schmelzpunkt von 211-213 °C.

63

In der nachfolgenden Tabelle 2 sind neben den vorstehend beschriebenen Benzoesäure-Derivaten der Formel I noch weitere Verbindungen der Formel I aufgeführt, die auf analoge Weise hergestellt wurden.

5

Tabelle 2:

Nr.	¹ H-NMR δ [ppm],	Schmp. [°C]
10	S-Enantiomer der Verbindung I-Aa.242 (CDCl ₃): 8,7 (br., 1 H), 8,0 m, 1 H), 7,5 (d, 1 H), 6,4 (s, 1 H), 5,4 (m, 1 H), 3,5 (s, 3 H), 2,9 (s, 6 H), 1,6 (d, 3 H).	207 - 208
15	S-Enantiomer der Verbindung I-Aa.243 (CDCl ₃): 8,7 (br., 1 H), 8,0 m, 1 H), 7,5 (d, 1 H), 6,4 (s, 1 H), 5,4 (m, 1 H), 3,5 (s, 3 H), 3,4 (q, 2 H), 2,9 (s, 3 H), 1,6 (d, 3 H), 1,3 (t, 3 H),	170 - 171
20	S-Enantiomer der Verbindung I-Aa.246 (CDCl ₃): 8,7 (br., 1 H), 8,0 m, 1 H), 7,5 (d, 1 H), 6,4 (s, 1 H), 5,4 (m, 1 H), 4,2 (m, 1 H), 3,5 (s, 3 H), 2,9 (s, 3 H), 1,6 (d, 3 H), 1,3 (d, 6 H).	164 - 165
25	S-Enantiomer der Verbindung I-Aa.251 (CDCl ₃): 8,7 (br., 1 H), 8,0 m, 1 H), 7,5 (d, 1 H), 6,4 (s, 1 H), 5,4 (m, 1 H), 3,6-3,4 (m, 7 H), 3,3 (s, 3 H), 2,9 (s, 3 H), 1,6 (d, 3 H).	132 - 134
30	S-Enantiomer der Verbindung I-Aa.265 (CDCl ₃): 8,7 (br., 1 H), 8,0 m, 1 H), 7,5 (d, 1 H), 6,4 (s, 1 H), 5,9-5,8 (m, 1 H), 5,5-5,1 (m, 3 H), 3,9 d, 1 H), 3,5 (s, 3 H), 2,9 (s, 3 H), 1,6 (d, 3 H).	129 - 130
35	S-Enantiomer der Verbindung I-Aa.269 (CDCl ₃): 8,7 (br., 1 H), 8,0 m, 1 H), 7,5 (d, 1 H), 6,4 (s, 1 H), 5,4 (m, 1 H), 4,2 (m, 2 H), 3,5 (s, 3 H), 2,9 (s, 3 H), 2,3 (m, 1 H), 1,6 (d, 3 H).	
40	I-Ab.465 (DMSO-d ₆): 11,7 (br. s, 1H), 7,9 (m, 1H), 7,7 (m, 1H), 7,6 (m, 1H), 6,6 (s, 1H), 5,8 (m, 1H), 5,3 - 5,2 (m, 2H), 3,8 (d, 2H), 3,4 (s, 3H), 2,8 (s, 3H), 1,6 (s, 6H).	161 - 164
40	I-Ab.469 (DMSO-d ₆): 11,7 (br. s, 1H), 7,9 (m, 1H), 7,7 (m, 1H), 7,6 (m, 1H), 6,6 (s, 1H), 4,1 (d, 2H), 3,4 (s, 3H), 3,3 (t, 3H), 2,8 (s, 3H), 1,6 (s, 6H).	
45	I-Ab.442 (DMSO-d ₆): 11,7 (br. s, 1H), 7,9 (m, 1H), 7,7 (m, 1H), 7,6 (m, 1H), 6,6 (s, 1H), 4,0 (m, 1H), 3,4 (s, 3H), 2,8 (s, 6H), 1,6 (s, 6H).	

Nr.	$^1\text{H-NMR } \delta \text{ [ppm]},$	Schmp. [°C]
5	S-Enantiomer von Verbindung Nr. I-Ab.248	Öl
10	S-Enantiomer von Verbindung I-Ab.242	Öl
15	S-Enantiomer von Verbindung I-Ab.243	Öl
20	S-Enantiomer von Verbindung I-Ab.265	Öl
	I-Ab.443	193-194
	I-Ab.446	177-179
	I-Ab.448	140-142
25	I-Aa.442 (DMSO- d_6): 11,63 (s, 1 H), 8,13 (d, 1 H), 7,91 (d, 1 H), 6,63 (s, 1 H), 3,42 (s, 3 H), 2,84 (s, 6 H), 1,61 (s, 6 H)	211-213

Anwendungsbeispiele

30

Die herbizide Wirkung der 3-Heterocyclyl substituierten Benzoesäure-Derivate I ließ sich durch die folgenden Gewächshausversuche zeigen:

35 Als Kulturgefäße dienten Plastikblumentöpfe mit lehmigem Sand mit etwa 3,0 % Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen wurden nach Arten getrennt eingesät.

Bei Voraufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteiler Düsen aufgebracht. Die Gefäße wurden leicht beregnet, um Keimung und Wachstum zu fördern, und anschließend mit durchsichtigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen waren. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Testpflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wurde.

Zum Zweck der Nachauflaufbehandlung wurden die Testpflanzen je nach Wuchsform erst bis zu einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm angezogen und erst dann mit den in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen behandelt. Die Testpflanzen wurden dafür
5 entweder direkt gesät und in den gleichen Gefäßen aufgezogen oder sie wurden erst als Keimpflanzen getrennt angezogen und einige Tage vor der Behandlung in die Versuchsgefäße verpflanzt. Die Aufwandmenge für die Nachauflaufbehandlung betrug 7,8 oder 3,9 g/ha a.S. (aktive Substanz).

10

Die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10 - 25°C bzw. 20 - 35°C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen gepflegt, und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde ausgewer-
15 tet.

Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachs-
20 tumsverlauf.

Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzten sich aus folgenden Arten zusammen:

25

Lateinischer Name	Deutscher Name	Englischer Name
Amaranthus retroflexus	Zurückgekrümmter Fuchsschwanz	redroot pigweed
Chenopodium album	Weißer Gänsefuß	lambsquarters (goosefoot)

30

Das S-Enantiomer der Verbindung I-Aa.246 zeigte im Nachauflaufverfahren eine hervorragende herbizide Wirkung gegen die o. g. Pflanzen.

35

Anwendungsbeispiele (desikkante/defoliantische Wirksamkeit)

Als Testpflanzen dienten junge, 4-blättrige (ohne Keimblätter) Baumwollpflanzen, die unter Gewächshausbedingungen angezogen wurden (rel. Luftfeuchtigkeit 50 bis 70 %; Tag-/Nachttemperatur
40 27/20°C).

Die jungen Baumwollpflanzen wurden tropfnass mit wässrigen Aufbereitungen der Wirkstoffe (unter Zusatz von 0,15 Gew.-% des Fettalkoholalkoxylats Plurafac® LF 700¹), bezogen auf die Spritz-
45 brühe) blattbehandelt. Die ausgebrachte Wassermenge betrug um-

¹) ein schaumarmes, nichtionisches Tensid der BASF AG

66

gerechnet 1000 l/ha. Nach 13 Tagen wurde die Anzahl der abgeworfenen Blätter und der Grad der Entblätterung in % bestimmt.

Bei den unbehandelten Kontrollpflanzen trat kein Blattfall auf.

5

10

15

20

25

30

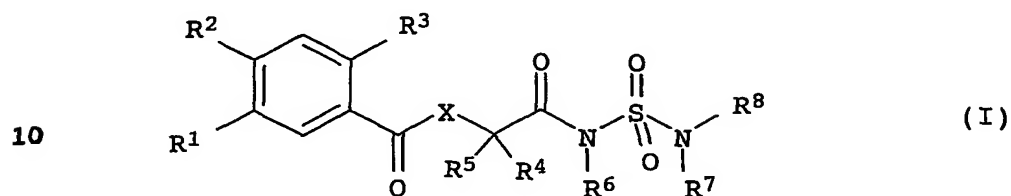
35

40

45

Patentansprüche

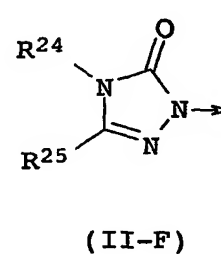
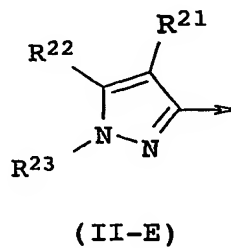
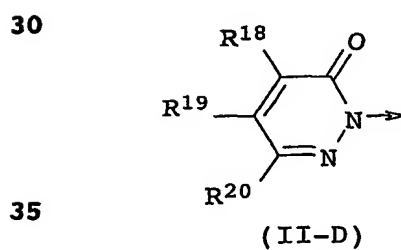
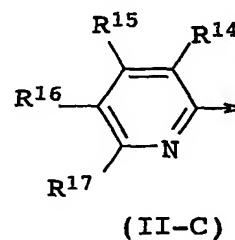
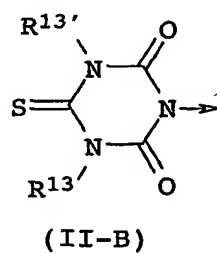
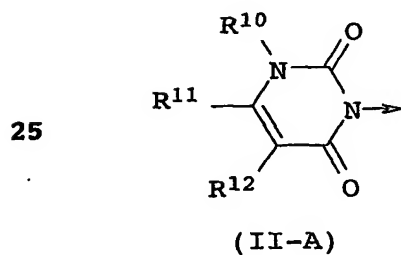
1. 3-Heterocyclyl substituierte Benzoessäure-Derivate der allgemeinen Formel I,



15 worin die Variablen die folgenden Bedeutungen haben:

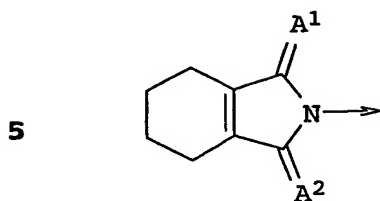
X Sauerstoff oder NR⁹,

20 R¹ heterocyclischer Rest der allgemeinen Formeln II-A bis II-H,

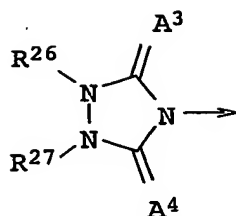


40

45



(II-G)



(II-H)

10

R² Wasserstoff oder Halogen,

R³ Halogen oder Cyano,

15

R⁴, R⁵ unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy, oder R⁴ und R⁵ stehen gemeinsam für eine Gruppe =CH₂,

R⁶ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy,

20

R⁷, R⁸ unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl, Cyano-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Amino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylamino-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₄-alkyl)amino-C₁-C₄-alkyl, Aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₄-Alkylamino)carbonyl-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Phenyl oder C₁-C₄-Alkylphenyl oder

25

30

35

40

45

R⁷ und R⁸ bilden gemeinsam mit dem Stickstoff-Atom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten 3-, 4-, 5-, 6- oder 7-gliedrigen Stickstoffheterocyclus, der gegebenenfalls ein oder zwei weitere Heteroatome, ausgewählt unter Stickstoff, Schwefel und Sauerstoff, als Ringglieder enthalten kann, der 1 oder 2 Carbonyl- und/oder Thiocarbonylgruppen als Ringglied enthalten kann, und/oder durch ein, zwei oder drei Substituenten, ausgewählt unter C₁-C₄-Alkyl und Halogen, substituiert sein kann,

R⁹ Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-Alkenyl oder C₃-C₆-Alkinyl,

- R¹⁰ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder Amino,
R¹¹ C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl,
R¹² Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl,
- 5 R¹³, R^{13'} unabhängig voneinander Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl,
- R¹⁴ Halogen,
R¹⁵ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl,
R¹⁶ C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkylthio,
10 C₁-C₄-Alkylsulfonyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyloxy,
R¹⁷ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl,
- R¹⁸ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder Amino,
R¹⁹ C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkylthio
15 oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl,
R²⁰ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl,
- R²¹ Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl,
R²² C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy,
20 C₁-C₄-Alkylthio oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl,
R²³ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl,
oder
R²² und R²³ bilden gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebun-
den sind, einen 5-, 6- oder 7-gliedrigen, gesättigten
25 oder ungesättigten Ring, der ein Heteroatom, das ausge-
wählt ist unter Sauerstoff und Stickstoff, als ringbil-
dendes Atom enthalten kann, und/oder der durch ein, zwei
oder drei Reste, ausgewählt unter C₁-C₄-Alkyl und Halo-
gen, substituiert sein kann,
- 30 R²⁴ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl,
R²⁵ C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl,
oder
R²⁴ und R²⁵ bilden gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebun-
den sind, einen 5-, 6- oder 7-gliedrigen, gesättigten
35 oder ungesättigten Ring, der gegebenenfalls ein Sauer-
stoffatom als ringbildendes Atom enthält, und/oder der
durch ein, zwei oder drei Reste, ausgewählt unter C₁-C₄-
Alkyl und Halogen, substituiert sein kann,
- 40 R²⁶ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl,
R²⁷ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl,
oder
R²⁶ und R²⁷ bilden gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebun-
den sind, einen 5-, 6- oder 7-gliedrigen, gesättigten
45 oder ungesättigten Ring, der gegebenenfalls ein Sauer-
stoffatom als ringbildendes Atom enthält, und/oder der

70

durch ein, zwei oder drei Reste, ausgewählt unter C₁-C₄-Alkyl und Halogen, substituiert sein kann,

5 A¹, A², A³, A⁴ jeweils unabhängig voneinander Sauerstoff oder Schwefel,

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

- 10 2. Benzoessäure-Derivate nach Anspruch 1, worin R² für Fluor, Chlor oder Wasserstoff steht.
3. Benzoessäure-Derivate nach Anspruch 1 oder 2, worin R³ für Chlor oder Cyano steht.
- 15 4. Benzoessäure-Derivate nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin X für Sauerstoff steht.
5. Benzoessäure-Derivate nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin R⁶ für Wasserstoff steht.
- 20 6. Benzoessäure-Derivate nach einem der Ansprüche 1 bis 5, worin R¹ einen heterocyclischen Rest der Formel II-A bedeutet, in der R¹⁰ für C₁-C₄-Alkyl oder Amino, R¹¹ für C₁-C₄-Halogenalkyl und R¹² für Wasserstoff stehen.
- 25 7. Benzoessäure-Derivate nach einem der Ansprüche 1 bis 5, worin R¹ einen heterocyclischen Rest der Formel II-B bedeutet, in der R¹³ und R^{13'} jeweils unabhängig voneinander für C₁-C₄-Alkyl stehen.
- 30 8. Benzoessäure-Derivate nach einem der Ansprüche 1 bis 5, worin R¹ einen heterocyclischen Rest der Formel II-C bedeutet, in der R¹⁴ für Fluor oder Chlor, R¹⁵ für Wasserstoff und R¹⁶ für C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl oder C₁-C₄-Alkylsulfo-
35 nyloxy stehen.
9. Benzoessäure-Derivate nach einem der Ansprüche 1 bis 5, worin R¹ einen heterocyclischen Rest der Formel II-D bedeutet, in der R¹⁸ für Wasserstoff, Methyl oder Amino, R¹⁹ für C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl und R²⁰ für Wasserstoff
40 stehen.
10. Benzoessäure-Derivate nach einem der Ansprüche 1 bis 5, worin R¹ einen heterocyclischen Rest der Formel II-E bedeutet, in
45 der R²¹ für Halogen oder C₁-C₄-Alkyl, R²² für C₁-C₄-Halogenal-

kyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl und R²³ für C₁-C₄-Alkyl stehen.

11. Benzoessäure-Derivate nach einem der Ansprüche 1 bis 5, worin
5 R¹ einen heterocyclischen Rest der Formel II-F bedeutet, in der R²⁴ für Wasserstoff, Methyl, Difluormethyl oder Trifluormethyl, R²⁵ für Methyl oder Trifluormethyl oder R²⁴ zusammen mit R²⁵ für eine Kette der Formel -(CH₂)₄- stehen.
- 10 12. Benzoessäure-Derivate nach einem der Ansprüche 1 bis 5, worin R¹ einen heterocyclischen Rest der Formel II-G bedeutet, in der A¹ und A² jeweils für Sauerstoff stehen.
13. Benzoessäure-Derivate nach einem der Ansprüche 1 bis 5, worin
15 R¹ einen heterocyclischen Rest der Formel II-H bedeutet, in der R²⁶ und R²⁷ jeweils unabhängig voneinander für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl stehen oder R²⁶ zusammen mit R²⁷ für eine Kette der Formeln: -CH₂-O-(CH₂)₂- oder -(CH₂)₄- stehen.
- 20 14. Benzoessäure-Derivate nach einem der Ansprüche 1 bis 13, worin
R² für Wasserstoff, Chlor oder Fluor steht,
R³ für Chlor oder Cyano steht,
R⁶ für Wasserstoff steht und
25 X für Sauerstoff steht.
15. Benzoessäure-Derivate nach einem der Ansprüche 1 bis 14, worin
R⁴ oder R⁵ für Wasserstoff und der andere Rest R⁴ oder R⁵ für C₁-C₄-Alkyl oder R⁴, R⁵ jeweils für Methyl stehen.
- 30 16. Mittel, enthaltend eine herbizid wirksame Menge mindestens eines 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivats der allgemeinen Formel I oder ein landwirtschaftlich brauchbares Salz von I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 15, und mindestens
35 einen inerten flüssigen und/oder festen Trägerstoff sowie gewünschtenfalls mindestens einen oberflächenaktiven Stoff.
17. Mittel zur Desikkation/Defoliation von Pflanzen, enthaltend
40 eine desikkant/defoliant wirksame Menge mindestens eines 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivats der allgemeinen Formel I oder ein landwirtschaftlich brauchbares Salz von I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 15, und mindestens einen inerten flüssigen und/oder festen Trägerstoff sowie ge-
45 wünschtenfalls mindestens einen oberflächenaktiven Stoff.

18. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs, dadurch gekennzeichnet, dass man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivates der allgemeinen Formel I oder ein landwirtschaftlich brauchbares Salz von I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 15, auf Pflanzen, deren Lebensraum und/oder auf Saatgut einwirken lässt.
19. Verfahren zur Desikkation/Defoliation von Pflanzen, dadurch gekennzeichnet, dass man eine desikkant/defoliant wirksame Menge mindestens eines 3-Heterocyclyl substituierten Benzoesäure-Derivates der allgemeinen Formel I oder ein landwirtschaftlich brauchbares Salz von I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 15, auf Pflanzen einwirken lässt.
20. Verwendung von 3-Heterocyclyl substituierten Benzoessäure-Derivaten der allgemeinen Formel I oder deren landwirtschaftlich brauchbaren Salzen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 15 als Herbizide oder zur Desikkation/Defoliation von Pflanzen.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No. ...

PCT/EP 03/08013

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D239/54 C07D401/12 C07D403/12 A01N43/54 A01N43/84

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 98 28280 A (FMC CORP., USA) 2 July 1998 (1998-07-02) Verbindungen 4,5,40 und insbesondere 47 claims 1,20,21; example 12; tables	1-20
Y	WO 01 83459 A (BASF AG) 8 November 2001 (2001-11-08) cited in the application claims 1,2,4-8; examples; table 1	1-20
Y	WO 92 06962 A (MONSANTO CO) 30 April 1992 (1992-04-30) claims 1,11,12,21,22; examples 137,138	1-20
P,Y	WO 03 029226 A (BASF AG ;DONOVAN STEPHEN F (US); LANGEVINE CHARLES M (US); MARINEL) 10 April 2003 (2003-04-10) claims 1-10,13-15,18; table 2B	1-20

☐ Further documents are listed in the "continuation" of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- * & * document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

22 October 2003

Date of mailing of the international search report

03/11/2003

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Hanisch, I

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No. ...

PCT/EP 03/08013

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9828280	A	02-07-1998	AU 5710898 A WO 9828280 A1	17-07-1998 02-07-1998
WO 0183459	A	08-11-2001	AU 5838401 A BG 106473 A CA 2383858 A1 CN 1383425 T CZ 20020805 A3 WO 0183459 A2 EP 1226127 A2 HU 0204434 A2 SK 3232002 A3 US 2002045550 A1 ZA 200201776 A	12-11-2001 31-10-2002 08-11-2001 04-12-2002 12-06-2002 08-11-2001 31-07-2002 28-04-2003 06-11-2002 18-04-2002 11-03-2003
WO 9206962	A	30-04-1992	US 5281571 A AT 174330 T AU 653758 B2 AU 8927591 A BG 97638 A BR 9107049 A CA 2092083 A1 CN 1061777 A , B CN 1090845 A , B CZ 9300637 A3 DE 69130614 D1 DE 69130614 T2 DK 553307 T3 EP 0553307 A1 EP 0791571 A1 ES 2059290 T1 FI 931708 A GR 3029621 T3 HU 64310 A2 HU 219574 B IE 913642 A1 IE 990098 A1 JP 6502637 T MX 9101637 A1 NZ 240282 A PL 168964 B1 PL 170158 B1 PL 169882 B1 PT 99261 A , B RU 2137761 C1 SK 35993 A3 WO 9206962 A1 US 5489571 A US 5536700 A US 5530126 A US 5600008 A US 5600016 A US 5496956 A ZA 9108291 A US 5866723 A	25-01-1994 15-12-1998 13-10-1994 20-05-1992 31-03-1994 28-09-1993 19-04-1992 10-06-1992 17-08-1994 15-12-1993 21-01-1999 08-07-1999 16-08-1999 04-08-1993 27-08-1997 16-11-1994 10-06-1993 30-06-1999 28-12-1993 28-05-2001 22-04-1992 01-11-2000 24-03-1994 05-06-1992 27-04-1994 31-05-1996 31-10-1996 30-09-1996 31-08-1992 20-09-1999 07-07-1993 30-04-1992 06-02-1996 16-07-1996 25-06-1996 04-02-1997 04-02-1997 05-03-1996 26-08-1992 02-02-1999
WO 03029226	A	10-04-2003	WO 03029226 A1	10-04-2003

PCT/EP 93/08013

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 7 C07D239/54 C07D401/12 C07D403/12 A01N43/54 A01N43/84

IPK 7 C07D

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	WO 98 28280 A (FMC CORP., USA) 2. Juli 1998 (1998-07-02) Verbindungen 4,5,40 und insbesondere 47 Ansprüche 1,20,21; Beispiel 12; Tabellen ---	1-20
Y	WO 01 83459 A (BASF AG) 8. November 2001 (2001-11-08) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1,2,4-8; Beispiele; Tabelle 1 ---	1-20
Y	WO 92 06962 A (MONSANTO CO) 30. April 1992 (1992-04-30) Ansprüche 1,11,12,21,22; Beispiele 137,138 --- -/--	1-20

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

- "&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist**

03/11/2003

Hanisch, I

INTERNATIONALER RESEARCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internat. Aktenzeichen

PCT/EP 03/08013

Im Recherchenbericht angeführtes Patentedokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9828280	A	02-07-1998	AU 5710898 A WO 9828280 A1	17-07-1998 02-07-1998
WO 0183459	A	08-11-2001	AU 5838401 A BG 106473 A CA 2383858 A1 CN 1383425 T CZ 20020805 A3 WO 0183459 A2 EP 1226127 A2 HU 0204434 A2 SK 3232002 A3 US 2002045550 A1 ZA 200201776 A	12-11-2001 31-10-2002 08-11-2001 04-12-2002 12-06-2002 08-11-2001 31-07-2002 28-04-2003 06-11-2002 18-04-2002 11-03-2003
WO 9206962	A	30-04-1992	US 5281571 A AT 174330 T AU 653758 B2 AU 8927591 A BG 97638 A BR 9107049 A CA 2092083 A1 CN 1061777 A ,B CN 1090845 A ,B CZ 9300637 A3 DE 69130614 D1 DE 69130614 T2 DK 553307 T3 EP 0553307 A1 EP 0791571 A1 ES 2059290 T1 FI 931708 A GR 3029621 T3 HU 64310 A2 HU 219574 B IE 913642 A1 IE 990098 A1 JP 6502637 T MX 9101637 A1 NZ 240282 A PL 168964 B1 PL 170158 B1 PL 169882 B1 PT 99261 A ,B RU 2137761 C1 SK 35993 A3 WO 9206962 A1 US 5489571 A US 5536700 A US 5530126 A US 5600008 A US 5600016 A US 5496956 A ZA 9108291 A US 5866723 A	25-01-1994 15-12-1998 13-10-1994 20-05-1992 31-03-1994 28-09-1993 19-04-1992 10-06-1992 17-08-1994 15-12-1993 21-01-1999 08-07-1999 16-08-1999 04-08-1993 27-08-1997 16-11-1994 10-06-1993 30-06-1999 28-12-1993 28-05-2001 22-04-1992 01-11-2000 24-03-1994 05-06-1992 27-04-1994 31-05-1996 31-10-1996 30-09-1996 31-08-1992 20-09-1999 07-07-1993 30-04-1992 06-02-1996 16-07-1996 25-06-1996 04-02-1997 04-02-1997 05-03-1996 26-08-1992 02-02-1999
WO 03029226	A	10-04-2003	WO 03029226 A1	10-04-2003

INTERNATIONALE FÖRSCHERCHENBERICHT

Internat. Aktenzeichen

PCT/EP 03/08013

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
P,Y	WO 03 029226 A (BASF AG ; DONOVAN STEPHEN F (US); LANGEVINE CHARLES M (US); MARINEL) 10. April 2003 (2003-04-10) Ansprüche 1-10,13-15,18; Tabelle 2B -----	1-20